

file

(19) 日本国特許庁 (J P)

(12) 公開特許公報 (A)

(11) 特許出願公開番号

特開平10-72434

(43) 公開日 平成10年(1998) 3月17日

(51) Int.Cl. ⁶	識別記号	庁内整理番号	F I	技術表示箇所
C 0 7 D 207/325			C 0 7 D 207/325	
A 0 1 N 43/36			A 0 1 N 43/36	A
43/50			43/50	A
43/56			43/56	B
43/653			43/653	L
審査請求 未請求 請求項の数 6 O L (全 98 頁) 最終頁に続く				

(21) 出願番号	特願平8-282487	(71) 出願人	000003986 日産化学工業株式会社 東京都千代田区神田錦町3丁目7番地1
(22) 出願日	平成8年(1996)10月24日	(72) 発明者	河村 保夫 千葉県船橋市坪井町722番地1 日産化学工業株式会社中央研究所内
(31) 優先権主張番号	特願平8-85414	(72) 発明者	北 浩 千葉県船橋市坪井町722番地1 日産化学工業株式会社中央研究所内
(32) 優先日	平8(1996)4月8日	(72) 発明者	中田 尚志 千葉県船橋市坪井町722番地1 日産化学工業株式会社中央研究所内
(33) 優先権主張国	日本 (J P)		
(31) 優先権主張番号	特願平8-164436		
(32) 優先日	平8(1996)6月25日		
(33) 優先権主張国	日本 (J P)		
		最終頁に続く	

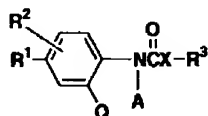
(54) 【発明の名称】 2, 4-置換アニリン誘導体

(57) 【要約】

【課題】 新規な農薬、特に除草剤を提供する。

【解決手段】 式：

【化1】



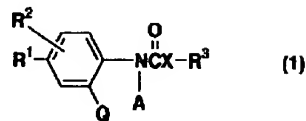
で表される2, 4-置換アニリン誘導体およびそれを含有する除草剤。式中、R¹はアルキル、ハロアルキルまたはアルコキシなどを表し、R²は水素、アルキルまたはハロアルキルなどを表し、R³はアルキル、シクロアルキルまたはアルケニルなどを表し、Xは酸素、硫黄、NR⁵または単結合を表し、Qはアゾール類などを表す。

1

【特許請求の範囲】

【請求項1】 式(1)：

【化1】



〔式中、R¹はC₁～C₄アルキル基、C₁～C₄ハロアルキル基、C₁～C₄アルコキシ基、C₁～C₄ハロアルコキシ基、C₁～C₄アルキルチオ基、C₁～C₃アルコキシC₁～C₃アルキル基、C₁～C₃アルキルチオC₁～C₃アルキル基、アセチル基またはハロゲン原子を表し、R²は水素原子、C₁～C₃アルキル基、C₁ハロアルキル基、C₁～C₃アルコキシ基、C₁ハロアルコキシ基、ハロゲン原子、ニトロ基またはシアノ基を表し、Aは水素原子、ホルミル基、(C₁～C₄アルキル)カルボニル基、(C₁～C₄ハロアルキル)カルボニル基、(C₁～C₄アルコキシ)カルボニル基、(C₂～C₄ハロアルコキシ)カルボニル基、(C₂～C₄アルケニル)カルボニル基、(C₁～C₄アルキルチオ)カルボニル基、(C₃～C₆シクロアルキル)カルボニル基、(C₃～C₆シクロアルコキシ)カルボニル基、C₁～C₄アルキルチオ基、C₁～C₄アルキルスルフィニル基、C₁～C₄アルキルスルホニル基、C₁～C₄ハロアルキルチオ基、C₁～C₄ハロアルキルスルフィニル基またはC₁～C₄ハロアルキルスルホニル基を表し、Xは酸素原子、硫黄原子、NR⁵(R⁵は水素原子またはC₁～C₃アルキル基を表す。)または単結合を表し、R³は

2

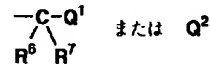
C₁～C₇アルキル基、C₃～C₇シクロアルキル基、C₂～C₆アルケニル基、C₅～C₇シクロアルケニル基、C₁～C₃アルコキシC₁～C₄アルキル基、C₁～C₃アルキルチオC₁～C₄アルキル基、(C₃～C₇シクロアルキル)C₁～C₄アルキル基、C₁～C₄ハロアルキル基、C₃～C₇シクロハロアルキル基、C₂～C₆ハロアルケニル基、C₂～C₆アルキニル基、C₂～C₆ハロアルキニル基または

【化2】



〔式中、ZはC₁～C₄アルキル基、ハロゲン原子、C₁～C₄アルコキシ基、C₁～C₄ハロアルキル基、C₁～C₄ハロアルコキシ基、C₁～C₄アルキルチオ基、C₁～C₄アルキルスルフィニル基、C₁～C₄アルキルスルホニル基、C₁～C₄ハロアルキルチオ基、C₁～C₄ハロアルキルスルフィニル基、C₁～C₄ハロアルキルスルホニル基、シアノ基、(C₁～C₄アルコキシ)カルボニル基、カルボキシ基またはニトロ基を表し、mは0から5の整数を表し、mが2から5の整数を表す場合、Zは同一でも異なってもよい。〕を表し、Qは

【化3】

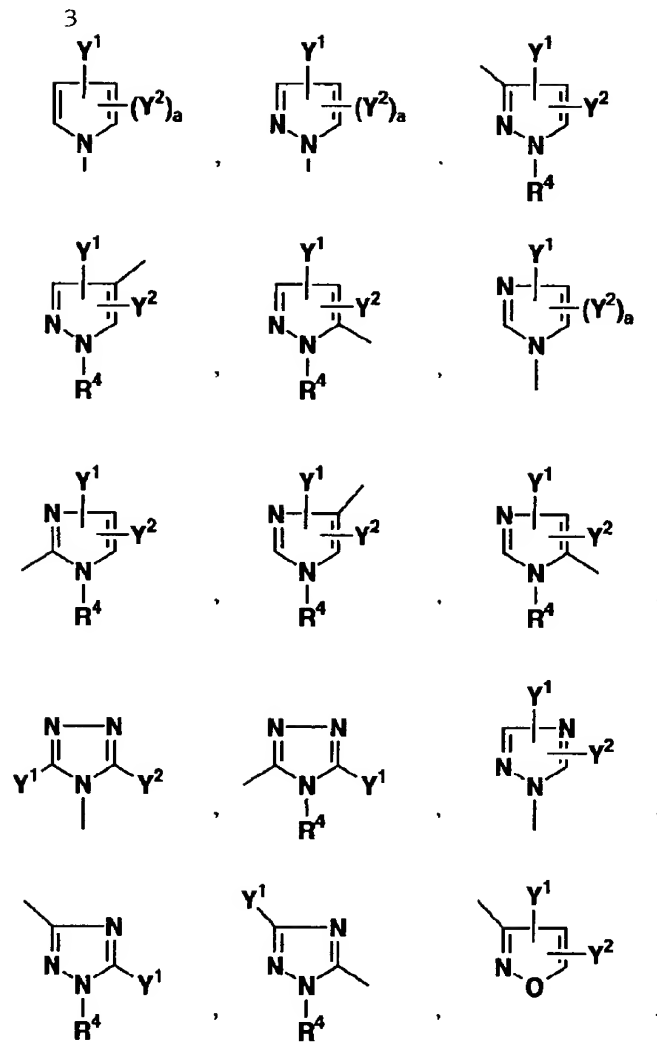


〔式中、R⁶、R⁷はそれぞれ独立に水素原子またはC₁～C₄アルキル基を表し、Q¹は

【化4】

(3)

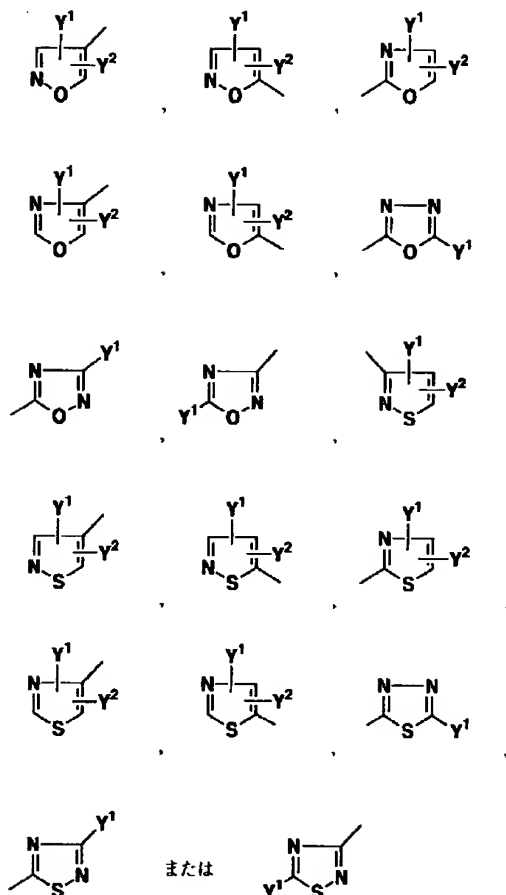
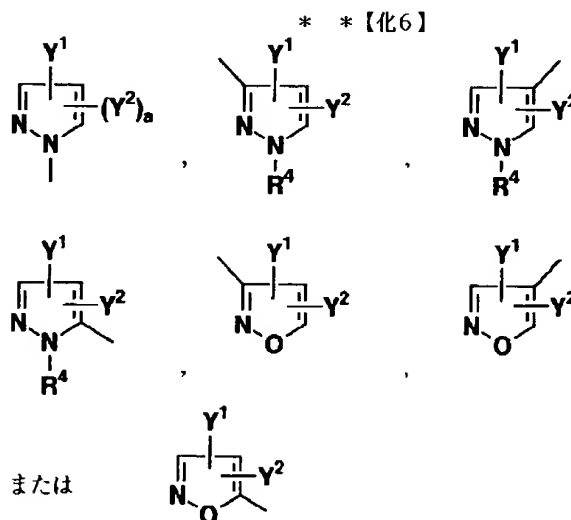
特開平10-72434



【化5】

5

6

を表し、Q²は

を表し、R⁴は水素原子またはC₁~C₄アルキル基を表し、Y¹はC₁~C₄ハロアルキル基、C₁~C₂ハロアルコキシ基、ハロゲン原子、ニトロ基、シアノ基、(C₁~C₄アルコキシ)カルボニル基またはカルボキシ基を表し、Y²は水素原子、ハロゲン原子、C₁~C₄アルキ

※ル基、C₁~C₄ハロアルキル基、C₁~C₄アルコキシ基、C₁~C₂ハロアルコキシ基、C₁~C₄アルキルチオ基、C₁~C₄アルキルスルフィニル基、C₁~C₄アルキルスルホニル基、C₁~C₄ハロアルキルチオ基、C₁~C₄ハロアルキルスルフィニル基、C₁~C₄ハロアルキ

ルスルホニル基、ニトロ基、シアノ基、(C₁~C₄アルコキシ)カルボニル基またはカルボキシ基を表し、aは1または2を表し、aが2を表す場合、Y²は同一でも異なってもよい。)を表す。]で表される2,4-置換アニリン誘導体。

【請求項2】 R¹がC₁~C₄アルキル基、C₁~C₄アルコキシ基またはハロゲン原子を表し、R²が水素原子を表す請求項1記載の2,4-置換アニリン誘導体。

【請求項3】 Qが

【化7】



を表す請求項2記載の2,4-置換アニリン誘導体。

【請求項4】 QがQ²を表す請求項2記載の2,4-置換アニリン誘導体。

【請求項5】 請求項1記載の2,4-置換アニリン誘導体を含有する農薬。

【請求項6】 請求項1記載の2,4-置換アニリン誘導体を含有する除草剤。

【発明の詳細な説明】

【0001】

【産業上の利用分野】本発明は新規な2,4-置換アニリン誘導体および該化合物を有効成分として含有する農薬、特に除草剤に関するものである。

【0002】

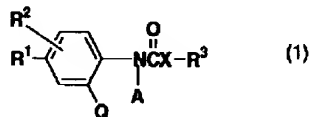
【従来の技術および課題】オルソ位に直接ヘテロ環またはメチレンを経由してヘテロ環を有するアニリン誘導体で除草活性を有する化合物が、WO-9309099およびWO-9509846に記載されている。また殺虫活性を有する化合物が特開平2-91062に、抗菌活性を有する化合物がEur. J. Med. Chem. 23(4), 311-317 (1988)に記載されている。

【0003】

【課題を解決するための手段】本発明は、式(1)：

【0004】

【化8】



【0005】〔式中、R¹はC₁~C₄アルキル基、C₁~C₄ハロアルキル基、C₁~C₄アルコキシ基、C₁~C₄ハロアルコキシ基、C₁~C₄アルキルチオ基、C₁~C₃アルコキシC₁~C₃アルキル基、C₁~C₃アルキルチオC₁~C₃アルキル基、アセチル基またはハロゲン原子を表し、R²は水素原子、C₁~C₃アルキル基、C₁ハロア

ルキル基、C₁~C₃アルコキシ基、C₁ハロアルコキシ基、ハロゲン原子、ニトロ基またはシアノ基を表し、Aは水素原子、ホルミル基、(C₁~C₄アルキル)カルボニル基、(C₁~C₄ハロアルキル)カルボニル基、(C₁~C₄アルコキシ)カルボニル基、(C₂~C₄ハロアルコキシ)カルボニル基、(C₂~C₄アルケニル)カルボニル基、(C₁~C₄アルキルチオ)カルボニル基、(C₃~C₆シクロアルキル)カルボニル基、(C₃~C₆シクロアルコキシ)カルボニル基、C₁~C₄アルキルチオ基、C₁~C₄アルキルスルフィニル基、C₁~C₄アルキルスルホニル基、C₁~C₄ハロアルキルチオ基、C₁~C₄ハロアルキルスルフィニル基またはC₁~C₄ハロアルキルスルホニル基を表し、Xは酸素原子、硫黄原子、NR⁵(R⁵は水素原子またはC₁~C₃アルキル基を表す。)または単結合を表し、R³はC₁~C₇アルキル基、C₃~C₇シクロアルキル基、C₂~C₆アルケニル基、C₅~C₇シクロアルケニル基、C₁~C₃アルコキシC₁~C₄アルキル基、C₁~C₃アルキルチオC₁~C₄アルキル基、(C₃~C₇シクロアルキル)C₁~C₄アルキル基、C₁~C₄ハロアルキル基、C₃~C₇シクロハロアルキル基、C₂~C₆ハロアルケニル基、C₂~C₆アルキニル基、C₂~C₆ハロアルキニル基または

【0006】

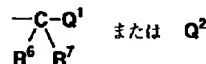
【化9】



【0007】〔式中、ZはC₁~C₄アルキル基、ハロゲン原子、C₁~C₄アルコキシ基、C₁~C₄ハロアルキル基、C₁~C₄ハロアルコキシ基、C₁~C₄アルキルチオ基、C₁~C₄アルキルスルフィニル基、C₁~C₄アルキルスルホニル基、C₁~C₄ハロアルキルチオ基、C₁~C₄ハロアルキルスルフィニル基、C₁~C₄ハロアルキルスルホニル基、シアノ基、(C₁~C₄アルコキシ)カルボニル基、カルボキシ基またはニトロ基を表し、mは0から5の整数を表し、mが2から5の整数を表す場合、Zは同一でも異なってもよい。)を表し、Qは

【0008】

40 【化10】



【0009】〔式中、R⁶、R⁷はそれぞれ独立に水素原子またはC₁~C₄アルキル基を表し、Q¹は

【0010】

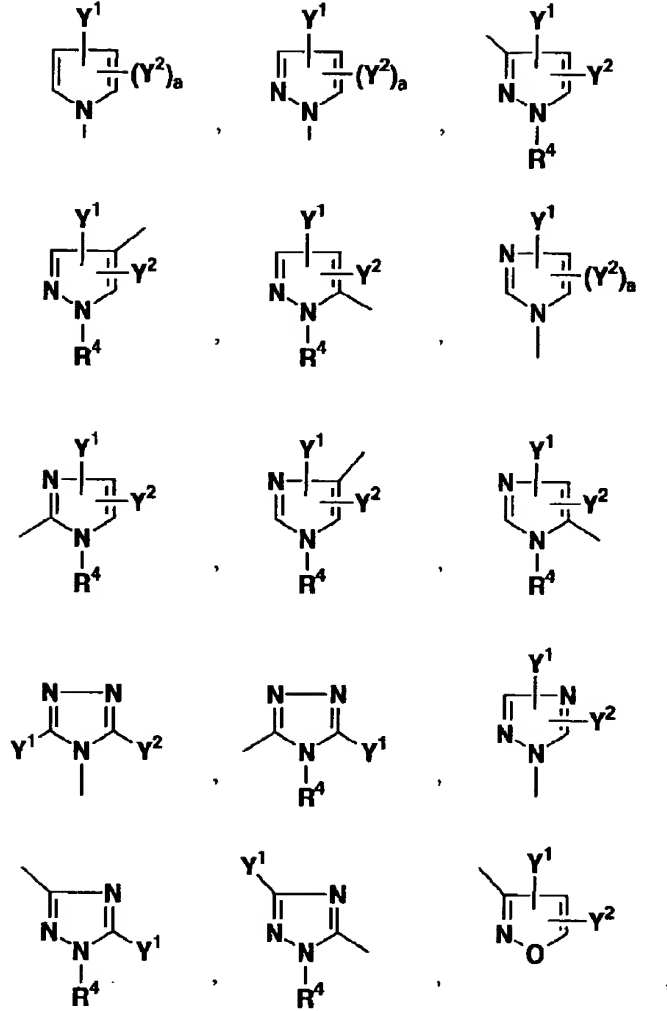
【化11】

(6)

特開平10-72434

9

10

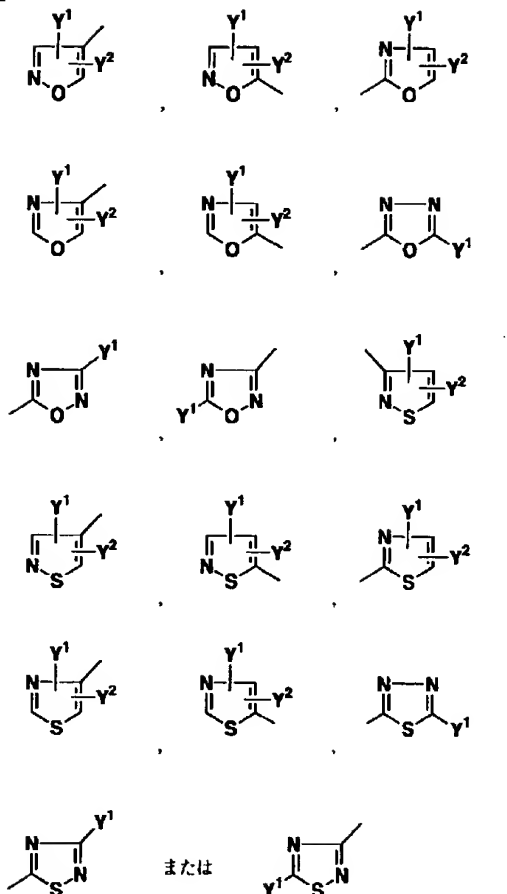


【0011】

* * 【化12】

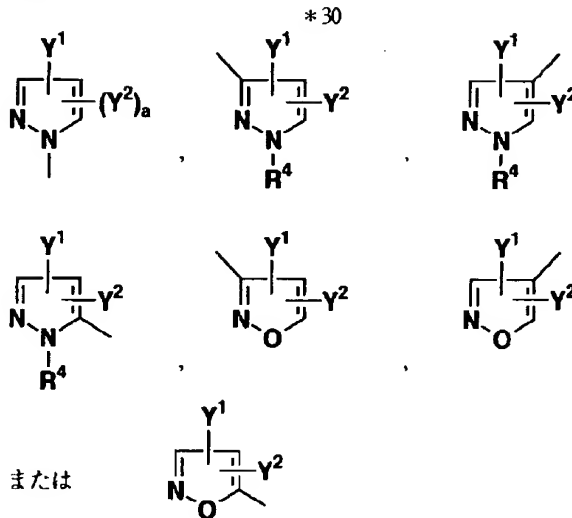
11

12

【0012】を表し、Q²は

*【化13】

【0013】



【0014】を表し、R⁴は水素原子またはC₁~C₄アルキル基を表し、Y¹はC₁~C₄ハロアルキル基、C₁~C₂ハロアルコキシ基、ハロゲン原子、ニトロ基、シアノ基、(C₁~C₄アルコキシ)カルボニル基またはカル

※ボキシ基を表し、Y²は水素原子、ハロゲン原子、C₁~C₄アルキル基、C₁~C₄ハロアルキル基、C₁~C₄アルコキシ基、C₁~C₂ハロアルコキシ基、C₁~C₄アルキルチオ基、C₁~C₄アルキルスルフィニル基、C₁~

13

C₄アルキルスルホニル基、C₁~C₄ハロアルキルチオ基、C₁~C₄ハロアルキルスルフィニル基、C₁~C₄ハロアルキルスルホニル基、ニトロ基、シアノ基、(C₁~C₄アルコキシ)カルボニル基またはカルボキシ基を表し、aは1または2を表し、aが2を表す場合、Y²は同一でも異なってもよい。)を表す。)で表される2, 4-置換アニリン誘導体(以下本発明化合物と称する。)および当該化合物を含有する農薬、特に除草剤である。

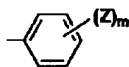
【0015】

【発明の実施の形態】以下に、式(1)の置換基をあげる。R¹としては、C₁~C₄アルキル基、C₁~C₄ハロアルキル基、C₁~C₄アルコキシ基、C₁~C₄ハロアルコキシ基、C₁~C₄アルキルチオ基、C₁~C₃アルコキシC₁~C₃アルキル基、C₁~C₃アルキルチオC₁~C₃アルキル基、アセチル基およびハロゲン原子があげられ、好ましいR¹としては、C₁~C₄アルキル基、C₁~C₄アルコキシ基およびハロゲン原子があげられる。

【0016】R²としては、水素原子、C₁~C₃アルキル基、C₁ハロアルキル基、C₁~C₃アルコキシ基、C₁ハロアルコキシ基、ハロゲン原子、ニトロ基およびシアノ基があげられ、好ましいR²としては水素原子があげられる。R³としては、C₁~C₇アルキル基、C₃~C₇シクロアルキル基、C₂~C₆アルケニル基、C₅~C₇シクロアルケニル基、C₁~C₃アルコキシC₁~C₄アルキル基、C₁~C₃アルキルチオC₁~C₄アルキル基、(C₃~C₇シクロアルキル)C₁~C₄アルキル基、C₁~C₄ハロアルキル基、C₃~C₇シクロハロアルキル基、C₂~C₆ハロアルケニル基、C₂~C₆アルキニル基、C₂~C₆ハロアルキニル基および

【0017】

【化14】



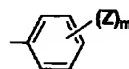
【0018】(式中、ZはC₁~C₄アルキル基、ハロゲン原子、C₁~C₄アルコキシ基、C₁~C₄ハロアルキル基、C₁~C₄ハロアルコキシ基、C₁~C₄アルキルチオ基、C₁~C₄アルキルスルフィニル基、C₁~C₄アルキルスルホニル基、C₁~C₄ハロアルキルチオ基、C₁~C₄ハロアルキルスルフィニル基、C₁~C₄ハロアルキルスルホニル基、シアノ基、(C₁~C₄アルコキシ)カルボニル基、カルボキシ基またはニトロ基を表し、mは0から5の整数を表し、mが2から5の整数を表す場合、Zは同一でも異なってもよい。)があげられ、好ましいR³としては、C₁~C₇アルキル基、C₃~C₇シクロアルキル基、C₂~C₆アルケニル基、C₁~C₃アルコキシC₁~C₄アルキル基、C₁~C₃アルキルチオC₁~

14

C₄アルキル基、(C₃~C₇シクロアルキル)C₁~C₄アルキル基、C₁~C₄ハロアルキル基、C₃~C₇シクロハロアルキル基、C₂~C₆ハロアルケニル基、C₂~C₆アルキニル基および

【0019】

【化15】



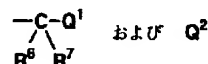
10 【0020】(式中、ZはC₁~C₄アルキル基、ハロゲン原子、C₁~C₄アルコキシ基、C₁~C₄ハロアルキル基、C₁~C₄ハロアルコキシ基、C₁~C₄アルキルチオ基、C₁~C₄アルキルスルフィニル基、C₁~C₄アルキルスルホニル基、C₁~C₄ハロアルキルチオ基、C₁~C₄ハロアルキルスルフィニル基、C₁~C₄ハロアルキルスルホニル基、シアノ基、(C₁~C₄アルコキシ)カルボニル基、カルボキシ基またはニトロ基を表し、mは0から5の整数を表し、mが2から5の整数を表す場合、Zは同一でも異なってもよい。)があげられる。

20 【0021】Aとしては水素原子、ホルミル基、(C₁~C₄アルキル)カルボニル基、(C₁~C₄ハロアルキル)カルボニル基、(C₁~C₄アルコキシ)カルボニル基、(C₂~C₄ハロアルコキシ)カルボニル基、(C₂~C₄アルケニル)カルボニル基、(C₁~C₄アルキルチオ)カルボニル基、(C₃~C₆シクロアルキル)カルボニル基、(C₃~C₆シクロアルコキシ)カルボニル基、C₁~C₄アルキルチオ基、C₁~C₄アルキルスルフィニル基、C₁~C₄アルキルスルホニル基、C₁~C₄ハロアルキルチオ基、C₁~C₄ハロアルキルスルフィニル基およびC₁~C₄ハロアルキルスルホニル基があげられ、好ましいAとしては、水素原子、ホルミル基、(C₁~C₄アルキル)カルボニル基、(C₁~C₄ハロアルキル)カルボニル基、(C₁~C₄アルコキシ)カルボニル基、(C₂~C₄ハロアルコキシ)カルボニル基、(C₂~C₄アルケニル)カルボニル基、(C₃~C₆シクロアルキル)カルボニル基および(C₃~C₆シクロアルコキシ)カルボニル基があげられる。

【0022】Qとしては

40 【0023】

【化16】



【0024】(式中、R⁶およびR⁷はそれぞれ独立に水素原子またはC₁~C₄アルキル基を表し、Q¹は

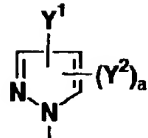
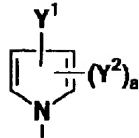
【0025】

【化17】

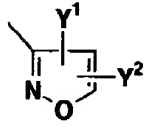
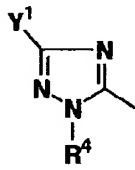
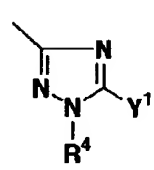
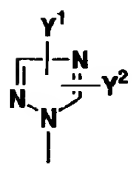
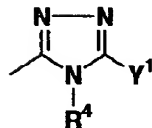
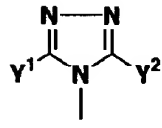
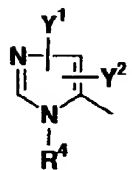
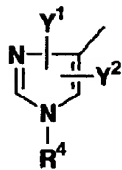
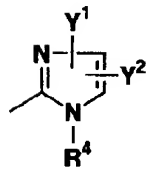
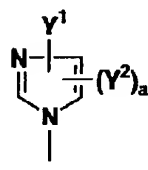
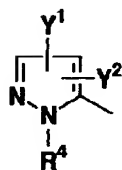
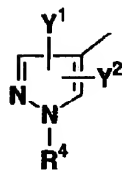
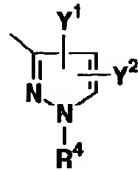
(9)

特開平10-72434

15



16

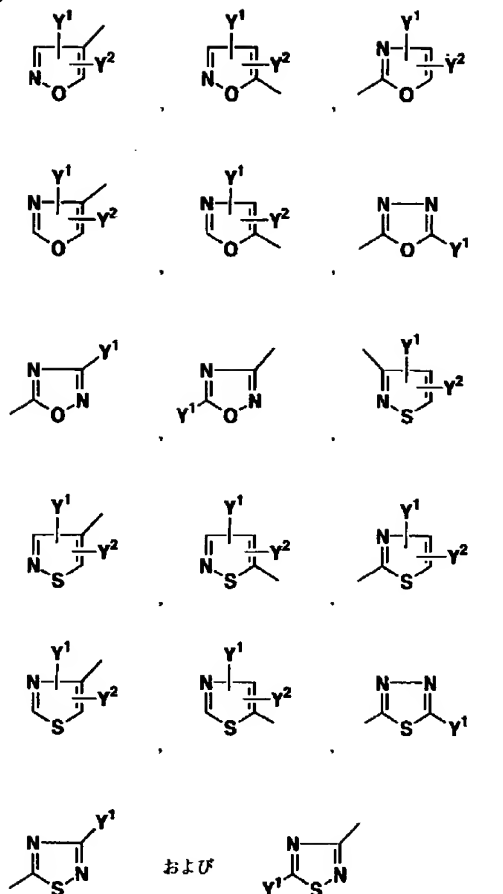


【0026】

* * 【化18】

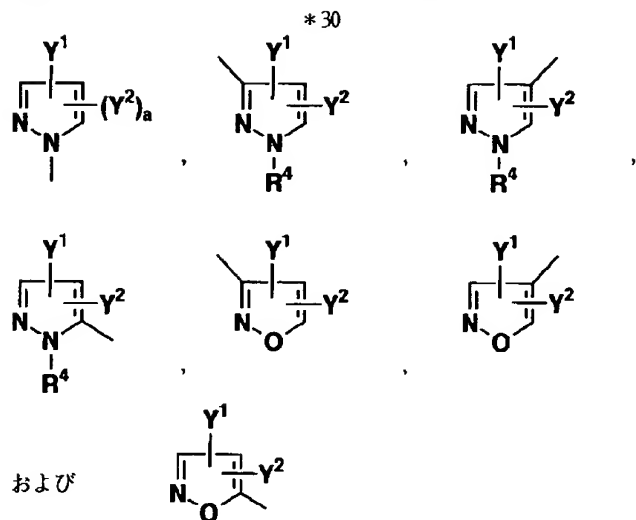
17

18



【0027】を表し、Q²は
【0028】

*【化19】



【0029】を表し、R⁴は水素原子またはC₁~C₄アルキル基を表し、Y¹はC₁~C₄ハロアルキル基、C₁~C₂ハロアルコキシ基、ハロゲン原子、ニトロ基、シア

※ボキシ基を表し、Y²は水素原子、ハロゲン原子、C₁~C₄アルキル基、C₁~C₄ハロアルキル基、C₁~C₄アルコキシ基、C₁~C₂ハロアルコキシ基、C₁~C₄アルキルチオ基、C₁~C₄アルキルスルフィニル基、C₁~

C₄アルキルスルホニル基、C₁~C₄ハロアルキルチオ基、C₁~C₄ハロアルキルスルフィニル基、C₁~C₄ハロアルキルスルホニル基、ニトロ基、シアノ基、(C₁~C₄アルコキシ)カルボニル基またはカルボキシ基を表し、aは1または2を表し、aが2を表す場合、Y²は同一でも異なってもよい。)があげられる。

【0030】次に具体的な置換基をあげる。R¹としては、メチル基、エチル基、n-プロピル基、iso-プロピル基、n-ブチル基、iso-ブチル基、sec-ブチル基、tert-ブチル基、トリフルオロメチル基、クロロメチル基、2-クロロエチル基、2-ブロモエチル基、2,3-ジクロロプロピル基、3-クロロプロピル基、1,2-ジクロロ-1-メチルエチル基、4-クロロブチル基、メトキシ基、エトキシ基、n-プロポキシ基、iso-プロポキシ基、n-ブトキシ基、iso-ブトキシ基、sec-ブトキシ基、tert-ブトキシ基、ジフルオロメトキシ基、トリフルオロメトキシ基、2,2,2-トリフルオロエトキシ基、2-クロロエトキシ基、2-ブロモエトキシ基、3-フルオロプロポキシ基、3-クロロプロポキシ基、4-クロロブトキシ基、メチルチオ基、エチルチオ基、n-プロピルチオ基、iso-プロピルチオ基、n-ブチルチオ基、iso-ブチルチオ基、sec-ブチルチオ基、tert-ブチルチオ基、メトキシメチル基、エトキシメチル基、n-プロポキシメチル基、iso-プロポキシメチル基、2-メトキシエチル基、2-エトキシエチル基、2-n-プロポキシエチル基、2-iso-プロポキシエチル基、1-メトキシエチル基、1-エトキシエチル基、1-n-プロポキシエチル基、1-iso-プロポキシエチル基、3-メトキシプロピル基、3-エトキシプロピル基、メチルチオメチル基、エチルチオメチル基、n-プロピルチオメチル基、iso-プロピルチオメチル基、2-メチルチオエチル基、2-エチルチオエチル基、2-n-プロピルチオエチル基、2-iso-プロピルチオエチル基、1-メチルチオエチル基、1-エチルチオエチル基、1-n-プロピルチオエチル基、1-iso-プロピルチオエチル基、3-メチルチオプロピル基、3-エチルチオプロピル基、アセチル基、弗素原子、塩素原子、臭素原子および沃素原子があげられる。

【0031】R²としては、水素原子、メチル基、エチル基、n-プロピル基、iso-プロピル基、トリフルオロメチル基、メトキシ基、エトキシ基、n-プロポキシ基、iso-プロポキシ基、トリフルオロメトキシ基、ジフルオロメトキシ基、弗素原子、塩素原子、臭素原子、沃素原子、ニトロ基およびシアノ基があげられる。

【0032】R³としては、メチル基、エチル基、n-プロピル基、iso-プロピル基、n-ブチル基、iso-ブチル基、sec-ブチル基、tert-ブチル

基、n-ペンチル基、iso-ペンチル基、2-メチルブチル基、sec-ペンチル基、tert-ペンチル基、1,2-ジメチルプロピル基、2,2-ジメチルプロピル基、1-エチルプロピル基、n-ヘキシル基、1-メチルペンチル基、2-メチルペンチル基、4-メチルペンチル基、1,1-ジメチルブチル基、1-エチルブチル基、2-エチルブチル基、n-ヘプタチル基、1-エチルペンチル基、1-n-プロピルブチル基、シクロプロピル基、1-メチルシクロプロピル基、2-メチルシクロプロピル基、1,2-ジメチルシクロプロピル基、2,2-ジメチルシクロプロピル基、2,3-ジメチルシクロプロピル基、2,2,3,3-テトラメチルシクロプロピル基、シクロブチル基、2-メチルシクロブチル基、3-メチルシクロブチル基、シクロペンチル基、2-メチルシクロペンチル基、3-メチルシクロペンチル基、シクロヘキシル基、1-メチルシクロヘキシル基、2-メチルシクロヘキシル基、シクロヘプタチル基、ビニル基、1-メチルビニル基、1-プロペニル基、アリル基、1-ブテニル基、2-ブテニル基、3-ブテニル基、1-メチル-1-プロペニル基、1-メチル-2-プロペニル基、1-エチルビニル基、2-メチル-1-プロペニル基、2-メチル-2-プロペニル基、1-ペンテニル基、2-ペンテニル基、3-ペンテニル基、4-ペンテニル基、1-メチル-1-ブテニル基、1-メチル-3-ブテニル基、3-メチル-1-ブテニル基、1,1-ジメチル-2-プロペニル基、1,2-ジメチル-1-プロペニル基、1-ヘキセニル基、2-ヘキセニル基、5-ヘキセニル基、1-メチル-1-ペンテニル基、1,3-ジメチル-1-ブテニル基、1-シクロペンテニル基、1-シクロヘキセニル基、3-シクロヘキセニル基、メトキシメチル基、エトキシメチル基、n-プロポキシメチル基、iso-プロポキシメチル基、2-メトキシエチル基、2-エトキシエチル基、2-n-プロポキシエチル基、2-iso-プロポキシエチル基、1-メトキシエチル基、1-メトキシプロピル基、1-エトキシプロピル基、1-エトキシエチル基、2-メトキシ-1-メチルエチル基、2-エトキシ-1-メチルエチル基、1-メトキシメチルプロピル基、1-エトキシメチルプロピル基、メチルチオメチル基、エチルチオメチル基、n-プロピルチオメチル基、iso-プロピルチオメチル基、2-メチルチオエチル基、2-エチルチオエチル基、1-メチルチオプロピル基、2-n-プロピルチオエチル基、2-iso-プロピルチオエチル基、1-メチルチオエチル基、1-エチルチオエチル基、2-メチルチオ-1-メチルエチル基、2-エチルチオ-1-メチルエチル基、1-メチルチオメチルプロピル基、1-エチルチオメチルプロピル基、シクロプロピルメチル基、シクロブチルメチル基、シクロペンチルメチル基、シクロヘキシルメチル基、シクロヘプタチルメチル基、1

21

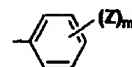
ーシクロプロピルエチル基、2-シクロプロピルエチル基、フルオロメチル基、クロロメチル基、プロモメチル基、ヨードメチル基、ジフルオロメチル基、ジクロロメチル基、クロロフルオロメチル基、クロロジフルオロメチル基、トリクロロメチル基、トリプロモメチル基、トリフルオロメチル基、1-フルオロエチル基、2-フルオロエチル基、1-クロロエチル基、2-クロロエチル基、1-プロモエチル基、2-プロモエチル基、1-ヨードエチル基、2-ヨードエチル基、2, 2, 2-トリフルオロエチル基、2, 2, 2-トリクロロエチル基、2, 2-ジクロロ-1-フルオロエチル基、1, 1, 2, 2-テトラフルオロエチル基、ペンタフルオロエチル基、1, 1-ジクロロエチル基、1, 2, 2, 2-テトラフルオロエチル基、1, 2-ジクロロエチル基、2-クロロ-1, 1, 2, 2-テトラフルオロエチル基、1, 2-ジプロモエチル基、ペンタクロロエチル基、1-クロロ-1-メチルエチル基、1-プロモ-1-メチルエチル基、1, 2-ジクロロ-1-メチルエチル基、1-クロロ-1, 2, 2, 2-テトラフルオロエチル基、1-プロモ-1, 2, 2, 2-テトラフルオロエチル基、1, 2-ジプロモ-1-メチルエチル基、1-クロロプロピル基、1-プロモプロピル基、ビス(トリフルオロメチル)メチル基、1, 2-ジクロロプロピル基、2, 3-ジクロロプロピル基、1-クロロプロピル基、1-プロモプロピル基、ヘクタフルオロプロピル基、1-クロロ-2-メチルプロピル基、1-プロモ-2-メチルプロピル基、1, 1-ビス(クロロメチル)エチル基、2-クロロ-1, 1-ジメチルエチル基、2, 2-ジクロロ-1, 1-ジメチルエチル基、ノナフルオロプロピル基、2, 3-ジクロロ-1-メチルプロピル基、1-クロロ-シクロプロピル基、2-クロロシクロプロピル基、2, 2-ジクロロシクロプロピル基、2, 2-ジメチルシクロプロピル基、2, 2-ジクロロ-1-メチルシクロプロピル基、2, 2-ジクロロ-3-メチルシクロプロピル基、2, 2-ジクロロ-3, 3-ジメチルシクロプロピル基、1-クロロシクロヘキシル基、1-クロロビニル基、1-プロモビニル基、2-クロロビニル基、2-プロモビニル基、2, 2-ジプロモビニル基、1-プロモメチルビニル基、2-クロロ-1-メチルビニル基、2-プロモ-1-メチルビニル基、1-クロロ-1-プロペニル基、1-プロモ-1-プロペニル基、2-プロモ-1-プロペニル基、2, 3, 3, 3-テトラクロロ-1-プロペニル基、3-クロロ-2-メチル-1-プロペニル基、1, 2, 3, 3, 4, 4, 4-ヘクタフルオロ-1-ブテニル基、2-トリフルオロメチル-1-プロペニル基、1-トリフルオロメチルビニル基、1-クロロメチルビニル基、1, 2-ジクロロビニル基、2, 2-ジクロロビニル基、1, 2, 2-トリクロロビニル基、2-クロロ-1-プロペニル基、3, 3, 3-トリフルオロ-2-トリフルオロメチル-

22

1-プロペニル基、2, 3-ジクロロ-2-プロペニル基、エチニル基、1-プロピニル基、2-プロピニル基、1-ブチニル基、2-クロロエチニル基、2-プロモエチニル基、2-ヨードエチニル基および

【0033】

【化20】



【0034】があげられ、Zとしては、メチル基、エチル基、n-プロピル基、iso-プロピル基、n-ブチル基、iso-ブチル基、sec-ブチル基、tert-ブチル基、弗素原子、塩素原子、臭素原子、沃素原子、メトキシ基、エトキシ基、n-プロボキシ基、iso-プロボキシ基、n-ブトキシ基、iso-ブトキシ基、sec-ブトキシ基、tert-ブトキシ基、トリフルオロメチル基、ジフルオロメチル基、ペンタフルオロエチル基、2-クロロエチル基、3-クロロプロピル基、クロロメチル基、ジフルオロメトキシ基、トリフルオロメトキシ基、2, 2, 2-トリフルオロエトキシ基、クロロジフルオロメトキシ基、プロモジフルオロメトキシ基、2-クロロエトキシ基、3-クロロプロボキシ基、メチルチオ基、エチルチオ基、n-プロピルチオ基、iso-プロピルチオ基、n-ブチルチオ基、iso-ブチルチオ基、sec-ブチルチオ基、tert-ブチルチオ基、メチルスルフィニル基、エチルスルフィニル基、n-プロピルスルフィニル基、iso-プロピルスルフィニル基、n-ブチルスルフィニル基、iso-ブチルスルフィニル基、sec-ブチルスルフィニル基、tert-ブチルスルフィニル基、メチルスルホニル基、エチルスルホニル基、n-プロピルスルホニル基、iso-プロピルスルホニル基、n-ブチルスルホニル基、iso-ブチルスルホニル基、sec-ブチルスルホニル基、tert-ブチルスルホニル基、ジフルオロメチルチオ基、トリフルオロメチルチオ基、クロロジフルオロメチルチオ基、プロモジフルオロメチルチオ基、ジフルオロメチルスルフィニル基、トリフルオロメチルスルフィニル基、クロロジフルオロメチルスルフィニル基、プロモジフルオロメチルスルフィニル基、ジフルオロメチルスルホニル基、トリフルオロメチルスルホニル基、クロロジフルオロメチルスルホニル基、プロモジフルオロメチルスルホニル基、ニトロ基、シアノ基、カルボキシ基、メトキシカルボニル基、エトキシカルボニル基、n-プロボキシカルボニル基、iso-プロボキシカルボニル基、n-ブトキシカルボニル基、iso-ブトキシカルボニル基、sec-ブトキシカルボニル基およびtert-ブトキシカルボニル基等があげられる。

【0035】Aとしては水素原子、ホルミル基、アセチル基、プロピオニル基、n-プロピルカルボニル基、i

23

so-アロピルカルボニル基、n-ブチルカルボニル基、iso-ブチルカルボニル基、sec-ブチルカルボニル基、tert-ブチルカルボニル基、フルオロアセチル基、クロロアセチル基、ブロモアセチル基、ヨードアセチル基、ジフルオロアセチル基、クロロフルオロアセチル基、ジクロロアセチル基、ジブロモアセチル基、トリフルオロアセチル基、クロロジフルオロアセチル基、ブロモジフルオロアセチル基、トリクロロアセチル基、トリブロモアセチル基、2-クロロアロピオニル基、2-フルオロアロピオニル基、2-ブロモアロピオニル基、2-ヨードアロピオニル基、3-フルオロアロピオニル基、3-クロロアロピオニル基、3-ブロモアロピオニル基、3-ヨードアロピオニル基、2, 3-ジクロロアロピオニル基、2, 3-ジブロモアロピオニル基、2, 3-ジフルオロアロピオニル基、2, 2-ジクロロアロピオニル基、2-フルオロ-3, 3-ジクロロアロピオニル基、3, 3, 3-トリフルオロアロピオニル基、3, 3, 3-トリクロロアロピオニル基、2, 2, 3, 3-テトラフルオロアロピオニル基、2, 2, 3, 3-テトラフルオロ-3-クロロアロピオニル基、20 ベンタフルオロアロピオニル基、ベンタクロロアロピオニル基、2, 3, 3, 3-テトラフルオロアロピオニル基、2-クロロ-2, 3, 3, 3-テトラフルオロアロピオニル基、2-ブロモ-2, 3, 3, 3-テトラフルオロアロピオニル基、2-フルオロ-2-メチルアロピオニル基、2-クロロ-2-メチルアロピオニル基、2-ブロモ-2-メチルアロピオニル基、2, 3-ジクロロ-2-メチルアロピオニル基、2, 3-ジブロモ-2-メチルアロピオニル基、3, 3, 3-トリフルオロ-2-トリフルオロメチルアロピオニル基、2-メチル-3, 3, 3-トリフルオロアロピオニル基、1-クロロアロピルカルボニル基、1-フルオロアロピルカルボニル基、1-ブロモアロピルカルボニル基、2, 3-ジクロロアロピルカルボニル基、1, 2-ジクロロアロピルカルボニル基、3-クロロ-2-メチルアロピオニル基、3-ブロモ-2-メチルアロピオニル基、2-クロロメチル-3-クロロアロピオニル基、1, 1, 2, 2, 3, 3, 3-ヘptaフルオロアロピルカルボニル基、1-クロロブチルカルボニル基、1-ブロモブチルカルボニル基、1-クロロ-2-メチルアロピルカルボニル基、1-ブロモ-2-メチルアロピルカルボニル基、2, 2-ビス(クロロメチル)アロピオニル基、3-クロロ-2, 2-ジメチルアロピオニル基、3, 3-ジクロロ-2, 2-ジメチルアロピオニル基、2, 3-ジクロロ-1-メチルアロピルカルボニル基、1, 1, 2, 2, 3, 3, 4, 4-ノナフルオロブチルカルボニル基、メトキシカルボニル基、エトキシカルボニル基、n-アロピルカルボニル基、iso-アロピルカルボニル基、n-ブトキシカルボニル基、iso-ブトキシカルボニル基、sec-ブトキシカルボニル基、

24

tert-ブトキシカルボニル基、2-フルオロエトキシカルボニル基、2-クロロエトキシカルボニル基、2-ブロモエトキシカルボニル基、2, 2, 2-トリフルオロエトキシカルボニル基、3-クロロアロピキシル基、ビス(トリフルオロメチル)メトキシカルボニル基、4-クロロブトキシカルボニル基、アクリロイル基、メタクリロイル基、クロトノイル基、2-アロベニルカルボニル基、1-ブテニルカルボニル基、2-ブテニルカルボニル基、3-ブテニルカルボニル基、1-メチル-1-アロベニルカルボニル基、1-メチル-2-アロベニルカルボニル基、2-メチル-1-アロベニルカルボニル基、2-メチル-2-アロベニルカルボニル基、2-エチルアクリロイル基、メチルチオカルボニル基、エチルチオカルボニル基、n-アロピルチオカルボニル基、iso-アロピルチオカルボニル基、n-ブチルチオカルボニル基、sec-ブチルチオカルボニル基、tert-ブチルチオカルボニル基、シクロアロピルカルボニル基、1-メチルシクロアロピルカルボニル基、2-メチルシクロアロピルカルボニル基、シクロブチルカルボニル基、シクロペンチルカルボニル基、シクロヘキシルカルボニル基、シクロアロピルオキシカルボニル基、1-メチルシクロアロピルオキシカルボニル基、2-メチルシクロアロピルオキシカルボニル基、シクロブチルオキシカルボニル基、シクロペンチルオキシカルボニル基、シクロヘキシルオキシカルボニル基、メチルチオ基、エチルチオ基、n-アロピルチオ基、iso-アロピルチオ基、n-ブチルチオ基、iso-ブチルチオ基、sec-ブチルチオ基、tert-ブチルチオ基、トリクロロメチルチオ基、トリフルオロメチルチオ基、クロロジフルオロメチルチオ基、ジクロロフルオロメチルチオ基、ベンタフルオロエチルチオ基、1, 1, 2, 2, 3, 3, 3-ヘptaフルオロアロピルチオ基、1, 1, 2, 2, 3, 3, 4, 4-ノナフルオロブチルチオ基、メチルスルフィニル基、エチルスルフィニル基、n-アロピルスルフィニル基、iso-アロピルスルフィニル基、n-ブチルスルフィニル基、iso-ブチルスルフィニル基、sec-ブチルスルフィニル基、tert-ブチルスルフィニル基、トリクロロメチルスルフィニル基、トリフルオロメチルスルフィニル基、クロロジフルオロメチルスルフィニル基、ジクロロフルオロメチルスルフィニル基、ベンタフルオロエチルスルフィニル基、1, 1, 2, 2, 3, 3, 3-ヘptaフルオロアロピルスルフィニル基、1, 1, 2, 2, 3, 3, 4, 4-ノナフルオロブチルスルフィニル基、メチルスルホニル基、エチルスルホニル基、n-アロピルスルホニル基、iso-アロピルスルホニル基、n-ブチルスルホニル基、iso-ブチルスルホニル基、sec-ブチルスルホニル基、te

25

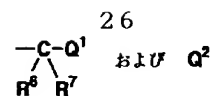
tert-ブチルスルホニル基、トリクロロメチルスルホニル基、トリフルオロメチルスルホニル基、クロロジフルオロメチルスルホニル基、ジクロロフルオロメチルスルホニル基、ペンタフルオロエチルスルホニル基、1, 1, 2, 2, 3, 3-ヘptaフルオロプロピルスルホニル基および1, 1, 2, 2, 3, 3, 4, 4, 4-ノナフルオロプロピルスルホニル基等があげられる。

【0036】Qとしては

【0037】

【化21】

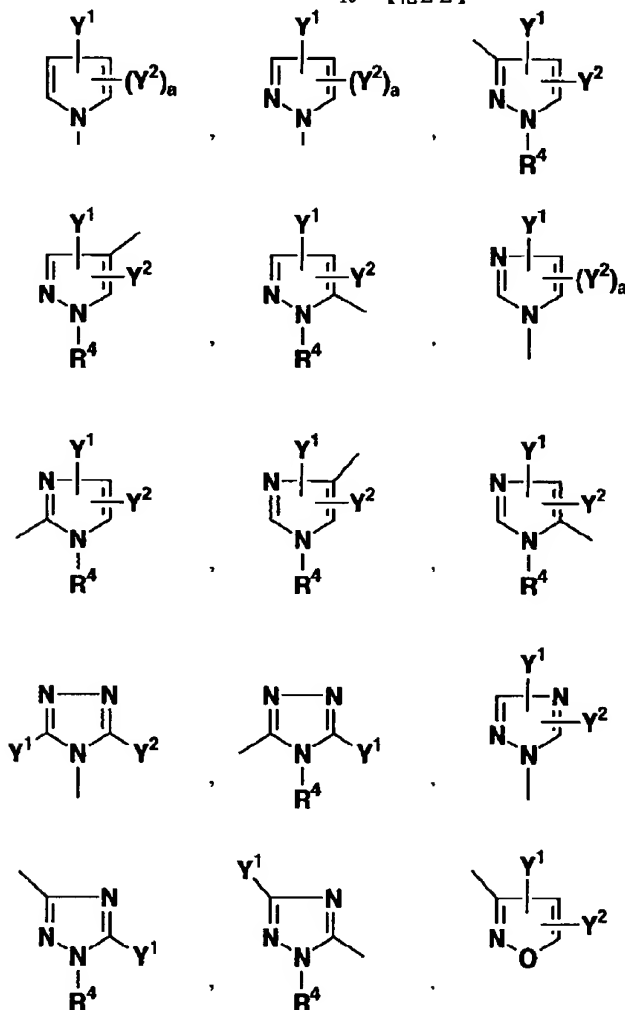
*



【0038】があげられ、 R^6 、 R^7 としてはそれぞれ独立に水素原子、メチル基、エチル基、n-プロピル基、iso-プロピル基、n-ブチル基、iso-ブチル基、sec-ブチル基およびtert-ブチル基があげられ、 Q^1 としては、

【0039】

*10 【化22】

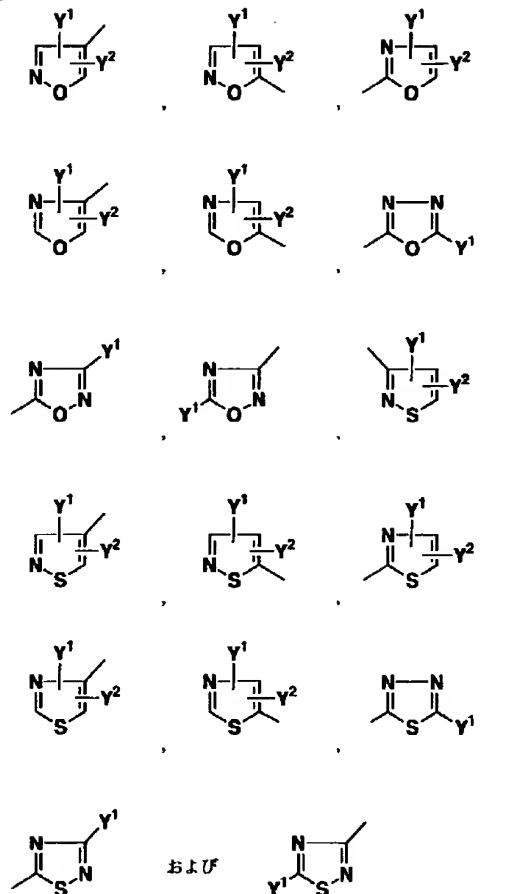


【0040】

※ ※ 【化23】

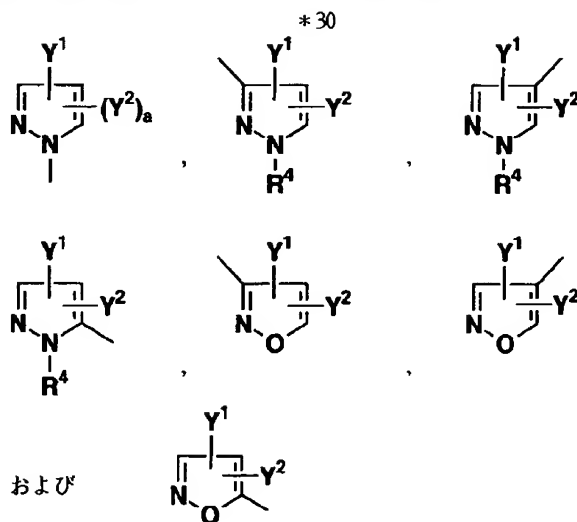
27

28



【0041】があげられ、Q²としては
【0042】

*【化24】



【0043】があげられ、Y¹としては、トリフルオロ
メチル基、ジフルオロメチル基、クロロジフルオロメチ
ル基、ペンタフルオロエチル基、ヘプタフルオロプロピ
ル基、トリフルオロメトキシ基、ジフルオロメトキシ

※基、クロロジフルオロメトキシ基、2, 2, 2-トリフ
ルオロエトキシ基、ペンタフルオロエトキシ基、弗素原
子、塩素原子、臭素原子、沃素原子、ニトロ基、シアノ
基、カルボキシ基、メトキシカルボニル基、エトキシカ

※50

ルボニル基、*n*-プロポキシカルボニル基、*iso*-プロポキシカルボニル基、*n*-ブトキシカルボニル基、*iso*-ブトキシカルボニル基、*sec*-ブトキシカルボニル基および*tert*-ブトキシカルボニル基があげられ、 Y^2 としては、水素原子、フッ素原子、塩素原子、臭素原子、沃素原子、メチル基、エチル基、*n*-プロピル基、*iso*-プロピル基、*n*-ブチル基、*iso*-ブチル基、*sec*-ブチル基、*tert*-ブチル基、ジフルオロメチル基、トリフルオロメチル基、クロロメチル基、ペンタフルオロエチル基、2-クロロエチル基、2-プロモエチル基、3-クロロプロピル基、2, 3-ジクロロプロピル基、メトキシ基、エトキシ基、*n*-プロポキシ基、*iso*-プロポキシ基、*n*-ブトキシ基、*iso*-ブトキシ基、*sec*-ブトキシ基、*tert*-ブトキシ基、ジフルオロメトキシ基、トリフルオロメトキシ基、2, 2, 2-トリフルオロエトキシ基、2-クロロエトキシ基、メチルチオ基、エチルチオ基、*n*-プロピルチオ基、*iso*-プロピルチオ基、*n*-ブチルチオ基、*iso*-ブチルチオ基、*sec*-ブチルチオ基、*tert*-ブチルチオ基、メチルスルフィニル基、エチルスルフィニル基、*n*-プロピルスルフィニル基、*iso*-プロピルスルフィニル基、*n*-ブチルスルフィニル基、*iso*-ブチルスルフィニル基、*sec*-ブチルスルフィニル基、*tert*-ブチルスルフィニル基、メチルスルホニル基、エチルスルホニル基、*n*-プロピルスルホニル基、*iso*-プロピルスルホニル基、*n*-ブチルスルホニル基、*iso*-ブチルスルホニル基、*sec*-ブチルスルホニル基、*tert*-ブチルスルホニル基、ジフルオロメチルチオ基、トリフルオロメチルチオ基、クロロジフルオロメチルチオ基、プロモジフルオロメチルチオ基、ジフルオロメチルスルフィニル基、トリフルオロメチルスルフィニル基、クロロジフルオロメチルスルフィニル基、プロモジフルオロメチルスルフィニル基、ジフルオロメチルスルホニル基、トリフルオロメチルスルホニル基、クロロジフルオロメチルスルホニル基、プロモジフルオロメチルスルホニル基、ニトロ基、シアノ基、カルボキシ基、メトキシカルボニル基、エトキシカルボニル基、*n*-プロポキシカルボニル基、*iso*-プロポキシカルボニル基、*n*-ブトキシカルボニル基、*iso*-ブトキシカルボニル基、*sec*-ブトキシ

カルボニル基および*tert*-ブトキシカルボニル基等があげられ、 R^3 としては、水素原子、メチル基、エチル基、*n*-プロピル基、*iso*-プロピル基、*n*-ブチル基、*iso*-ブチル基、*sec*-ブチル基および*tert*-ブチル基があげられる。

【0044】 X としては、酸素原子、硫黄原子、アミノ基、メチルアミノ基、エチルアミノ基、*n*-プロピルアミノ基、*iso*-プロピルアミノ基および単結合があげられる。本発明化合物は、畑地、水田、非耕地用除草剤として、土壌処理、土壌混和処理、茎葉処理のいずれの処理方法においても使用できる。

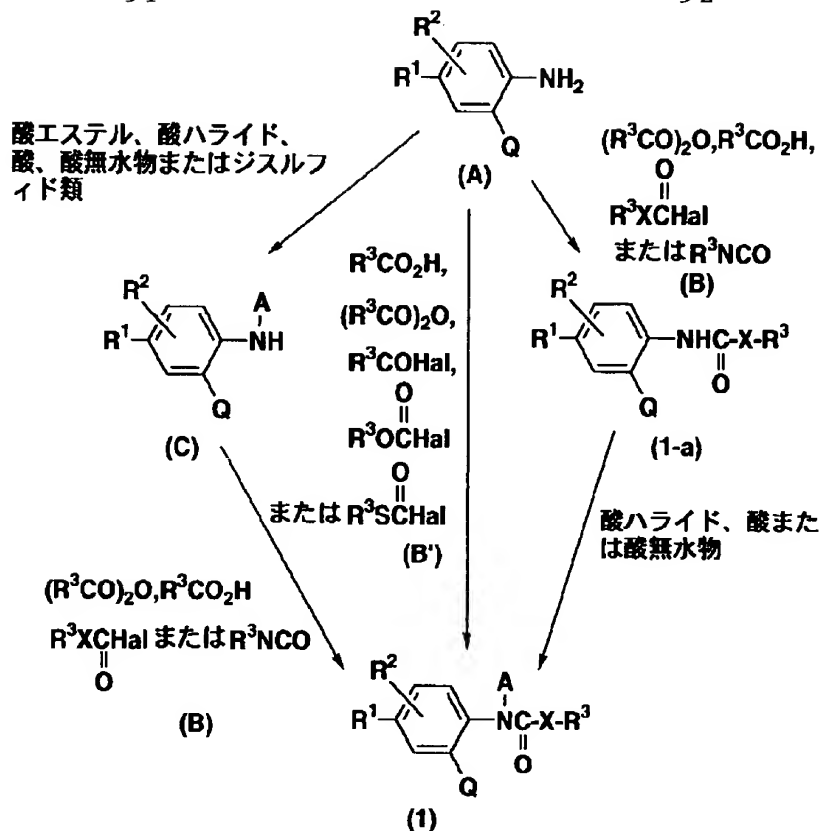
【0045】本発明化合物を含有する除草剤の対象雑草としては、イヌホウズキ、チョウセンアサガオ、イチビ、アメリカキンゴジカ、アルバアサガオ、イヌビユ、アオビユ、オナモミ、ブタクサ、ヒマワリ、ハギダメグク、セイヨウトゲアザミ、ノボロギク、ヒメジョオン、イヌガラシ、ノハラガラシ、ナズナ、イヌタデ、ソバカズラ、スベリヒユ、シロザ、コアカザ、ホウキギ、ハコベ、オオイヌノフグリ、ツユクサ、ホトケノザ、ヒメオドリコソウ、コニシキソウ、オオニシキソウ、ヤエムグラ、アカネ、スミレ、アメリカツノクサネム、エビスグサ、コセンダングサ等の広葉雑草、野生ソルガム、オオクサキビ、ジョンソングラス、イヌビユ、メヒシバ、カラスムギ、オヒシバ、エノコログサ、スズメノテッポウ等のイネ科雑草、ハマスゲ等のカヤツリグサ科雑草、ヘラオモダカ、オモダカ、ウリカワ、タマガヤツリ、ミズガヤツリ、ホタルイ、クログワイ、アゼナ、コナギ、ヒルムシロ、キカングサ、タイヌビエ等の各種水田雑草があげられる。

【0046】本発明化合物を含有する除草剤の対象作物としては、重要作物であるコムギ、オオムギ、トウモロコシ、ダイズ、イネ、ワタ、ビート、ソルガム等があげられる。また、本発明化合物を含有する除草剤は、落葉剤(defoliant)としても有用である。

【0047】本発明化合物は、例えば次に示す方法(スキーム1)によって合成することができる。(スキーム1のQ、A、 R^1 、 R^2 、 R^3 およびXは前記と同様の意味を表し、Halはハロゲン原子を表す。)

【0048】

【化25】



【0049】スキーム1はアニリン誘導体(A)を出発原料として3種の合成ルートを示している。一つはアニリン誘導体(A)に酸、酸無水物、酸ハライドまたは酸エステルなど(B)を反応させ本発明化合物(1-a)を合成し、さらにカルボン酸、スルフェン酸、スルフィン酸またはスルホン酸もしくは、これら酸の酸ハロゲン化物や酸無水物を反応させ、本発明化合物(1)を合成する方法を表す。

【0050】もう一つは、アニリン誘導体(A)に酸エステル、酸、酸無水物、酸ハライドまたはジスルフィド類を反応させ化合物(C)を合成し、さらに酸、酸無水物、酸ハライドまたは酸エステルなど(B)を反応させ本発明化合物(1)を合成する方法を表す。最後の一つは、アニリン誘導体(A)に酸、酸無水物、酸ハライドなど(B')を反応させ本発明化合物(1)を直接一段階で合成する方法を表す。

【0051】本発明化合物を精製する必要がある場合*

*には、再結晶、カラムクロマトグラフィー等の任意の精製法によって分離、精製することができる。なお、本発明に包含される化合物の中で不斉炭素を有する場合には、光学活性な化合物(+)体および(-)体が含まれる。幾何異性体が存在する場合には、シス体およびトランス体が含まれる。

【0052】以下に本発明化合物の合成例を実施例として具体的に述べるが、本発明はこれらによって限定されるものではない。

【0053】

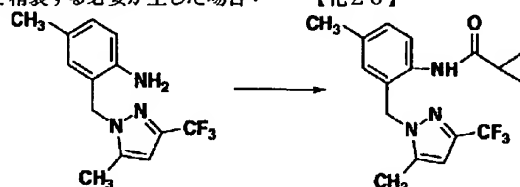
【実施例】

【実施例1】

1-(2-シクロアロパンカルボニルアミノ-5-メチルフェニルメチル)-5-メチル-3-トリフルオロメチルピラゾール(化合物No. C-4)の合成

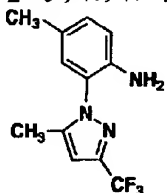
【0054】

【化26】

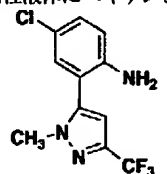


33

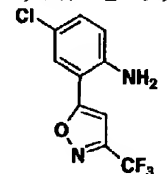
【0055】1-(2-アミノ-5-メチルフェニルメチル)-5-メチル-3-トリフルオロメチルピラゾール0.52g(1.93mmol)のピリジン5ml溶液中に、氷冷下、シクロプロパンカルボニルクロライド0.2ml(2.20mmol)をゆっくりと滴下した。滴下終了後、その反応液を氷冷下で1時間撹拌した。反応が終了したことを確認した後、そのピリジン溶液を水中にゆっくりと加えた。析出してきた結晶をろ取し、水、次いでヘキサンで十分に洗浄したところ、目的とする1-(2-シクロプロパンカルボニル



【0058】1-(2-アミノ-5-メチルフェニル)-5-メチル-3-トリフルオロメチルピラゾール0.33g(1.29mmol)のピリジン4ml溶液中に、氷冷下、シクロプロパンカルボニルクロライド0.13ml(1.43mmol)をゆっくりと滴下した。滴下終了後、その反応液を氷冷下で1時間撹拌した。反応が終了したことを確認した後、そのピリジン溶液を水中にゆっくりと加えた。そして、酢酸エチルで抽出した後、その酢酸エチル層を順次、十分に、水、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液、水、希塩酸、水そして飽和食塩水で洗浄した。酢酸エチル抽出液を無水硫酸ナトリウムで乾燥した後、減圧下で留去したところ、粘性液体が得られた。その粘性液体にヘキサンを加え結



【0061】5-(2-アミノ-5-クロロフェニル)-1-メチル-3-トリフルオロメチルピラゾール0.15g(0.55mmol)およびピリジン0.06g(0.76mmol)のTHF2ml溶液中に、氷冷下、シクロプロパンカルボニルクロライド0.05ml(0.55mmol)を滴下した。滴下終了後、その反応液を室温で1.5時間撹拌した。反応が終了したことを確認した後、その反応液を水中に加えた。析出してきた結晶をろ取し、水、次いでヘキサンで十分に洗浄したところ、目的とする5-(5-クロロ-2-シクロプロ



【0064】5-(2-アミノ-5-クロロフェニル)-1-メチル-3-トリフルオロメチルイソキサゾール0.09g(0.34mmol)のTHF2ml溶液中に、氷冷下、シクロプロパンカルボニルクロライド0.

34

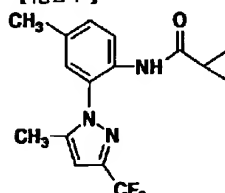
*ニルアミノ-5-メチルフェニルメチル)-5-メチル-3-トリフルオロメチルピラゾールが白色結晶として0.58g(収率=89%)得られた。

【0056】〔実施例2〕

1-(2-シクロプロパンカルボニルアミノ-5-メチルフェニル)-5-メチル-3-トリフルオロメチルピラゾール(化合物No.C-16)の合成

【0057】

【化27】



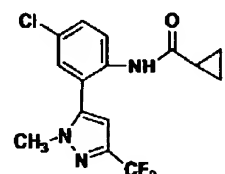
※晶化させ、その結晶を十分にヘキサンで洗浄したところ、目的とする1-(2-シクロプロパンカルボニルアミノ-5-メチルフェニル)-5-メチル-3-トリフルオロピラゾールが白色結晶として0.3g(収率=72%)得られた。

【0059】〔実施例3〕

5-(5-クロロ-2-シクロプロパンカルボニルアミノフェニル)-1-メチル-3-トリフルオロメチルピラゾール(化合物No.C-20)の合成

【0060】

【化28】



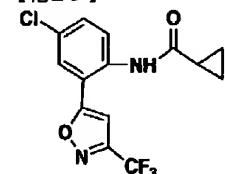
★バンカルボニルアミノフェニル)-1-メチル-3-トリフルオロメチルピラゾールが結晶として0.18g(収率=96%)得られた。

【0062】〔実施例4〕

5-(5-クロロ-2-シクロプロパンカルボニルアミノフェニル)-3-トリフルオロメチルイソキサゾール(化合物No.C-27)の合成

【0063】

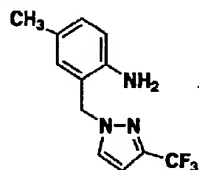
【化29】



【0064】5-(2-アミノ-5-クロロフェニル)-1-メチル-3-トリフルオロメチルイソキサゾール0.09g(0.34mmol)のTHF2ml溶液中に、氷冷下、シクロプロパンカルボニルクロライド0.

35

0.4ml (0.34mmol)を滴下した。滴下終了後、その反応液を室温で1時間攪拌した。反応が終了したことを確認した後、その反応液を水中に加えた。析出してきた結晶を濾取し、水、次いでヘキサンで十分に洗浄したところ、目的とする5-(5-クロル-2-シクロプロパンカルボニルアミノフェニル)-3-トリフルオロイソオキサゾールが結晶として0.11g (収率=97%) が得られた。*

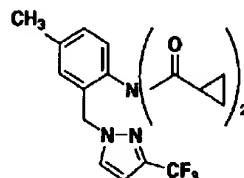


*【実施例5】

1-[2-ビス(シクロプロパンカルボニル)イミノ-5-メチルフェニルメチル]-3-トリフルオロメチルピラゾール(化合物No. D-1)の合成

【0065】

【化30】



【0066】1-(2-アミノ-5-メチルフェニルメチル)-3-トリフルオロメチルピラゾール0.28g (1.09mmol)およびトリエチルアミン3.5mlのTHF 5ml溶液中に、氷冷下、シクロプロパンカルボニルクロライド0.44ml (4.85mmol)を滴下した。滴下終了後、その反応液を室温で30分間攪拌して3時間還流した。反応が終了したことを確認した後、その溶液を水中にゆっくりと加えた。そして、酢酸エチルで抽出した後、その酢酸エチル層を順次、十分に、希塩酸、水、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液、水そして飽和食塩水で洗浄した。酢酸エチル抽出液を無水硫酸ナトリウムで乾燥した後、減圧留去したところ、粘性液体が得られた。この粘性液体を分取液体クロマトグラフィーで精製したところ、目的とする1-[2-ビス(シクロプロパンカルボニル)イミノ-5-メチルフェニル]

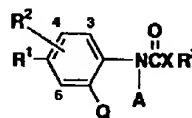
※ニルメチル)-3-トリフルオロメチルピラゾールが白色結晶として0.33g (収率=76%) 得られた。

【0067】前記スキームあるいは実施例に準じて合成した本発明化合物を前記実施例で合成した化合物も含めて、構造式を表1-aと表1-bに、物性を表2-aと表2-bに示す。

20 【0068】〔表1-a〕

【0069】

【化31】



【0070】

【表1】

化合物No.	R ¹	R ²	XR ³	Q
(A=Hの場合)				
C-1	Me	—	c-Pro	3-CF ₃ -Q-5(R ⁴ :Me)
C-2	Me	—	O-i-Pro	3-CF ₃ -Q-5(R ⁴ :Me)
C-3	Me	—	CF ₃	3-CF ₃ -Q-5(R ⁴ :Me)
C-4	Me	—	c-Pro	CH ₂ (3-CF ₃ -5-Me-Q-2)
C-5	Me	—	c-Pro	CH ₂ (3-Me-5-CF ₃ -Q-2)
C-6	Me	—	O-i-Pro	CH ₂ (3-CF ₃ -5-Me-Q-2)
C-7	Me	—	Ph	CH ₂ (3-CF ₃ -5-Me-Q-2)
C-8	Me	—	CF ₃	CH ₂ (3-CF ₃ -5-Me-Q-2)
C-9	Me	—	CH=CHMe ₂	CH ₂ (3-CF ₃ -5-Me-Q-2)
C-10	Me	—	i-Pro	CH ₂ (3-CF ₃ -5-Me-Q-2)
C-11	Me	4-NO ₂	i-Pro	CH ₂ (3-CF ₃ -5-Me-Q-2)
C-12	Me	—	2,4-F ₂ -Ph	CH ₂ (3-CF ₃ -5-Me-Q-2)
C-13	Me	—	c-Pro	CH ₂ (3,5-(CF ₃) ₂ -Q-2)
C-14	Me	—	i-Pro	CH ₂ (3,5-(CF ₃) ₂ -Q-2)
C-15	Me	—	CF ₃	CH ₂ (3,5-(CF ₃) ₂ -Q-2)
C-16	Me	—	c-Pro	3-CF ₃ -5-Me-Q-2
C-17	Me	—	i-Pro	3-CF ₃ -5-Me-Q-2
C-18	Me	—	CF ₃	3-CF ₃ -5-Me-Q-2

(20)

特開平10-72434

37

38

C-19	Me	—	i-Pro	CH ₂ (3-CF ₃ -4-Cl-5-Me-Q-2)
C-20	Cl	—	c-Pro	3-CF ₃ -Q-5(R ⁴ :Me)
C-21	Cl	—	-CH=CHMe ₂	3-CF ₃ -Q-5(R ⁴ :Me)
C-22	Cl	—	CF ₃	3-CF ₃ -Q-5(R ⁴ :Me)

【0071】

* * 【表2】

化合物No.	R ¹	R ²	XR ³	Q
C-23	Cl	—	2,4-F ₂ -Ph	3-CF ₃ -Q-5(R ⁴ :Me)
C-24	Me	—	c-Pro	CH ₂ (3,5-Cl ₂ -4-CO ₂ Me-Q-2)
C-25	Cl	—	c-Pro	5-CF ₃ -Q-3(R ⁴ :Me)
C-26	Cl	—	c-Pro	5-CF ₃ -Q-15
C-27	Cl	—	c-Pro	3-CF ₃ -Q-17
C-28	Cl	—	CF ₃	5-CF ₃ -Q-15
C-29	Cl	—	2,4-F ₂ -Ph	5-CF ₃ -Q-15
C-30	Cl	—	-CH=CHMe ₂	5-CF ₃ -Q-15
C-31	Me	—	c-Pro	CH ₂ (3-CF ₃ -Q-2)
C-32	Me	—	i-Pro	CH ₂ (3-CF ₃ -Q-2)
C-33	Cl	—	c-Pro	CHMe (3-CF ₃ -5-Me-Q-2)
C-34	Cl	—	2,4-F ₂ -Ph	CHMe (3-CF ₃ -5-Me-Q-2)
C-35	Me	—	2,4-F ₂ -Ph	CH ₂ (3,5-Cl ₂ -4-CO ₂ Me-Q-2)
C-36	Me	—	2,4-F ₂ -Ph	3-CF ₃ -5-Me-Q-2
C-37	Cl	—	i-Pro	CHMe (3-CF ₃ -5-Me-Q-2)
C-38	Cl	—	CF ₃	CHMe (3-CF ₃ -5-Me-Q-2)
C-39	Me	—	C ₂ F ₅	CH ₂ (3-CF ₃ -5-Me-Q-2)
C-40	Me	—	Et	CH ₂ (3-CF ₃ -5-Me-Q-2)
C-41	Me	—	2-Me-c-Pro	CH ₂ (3-CF ₃ -5-Me-Q-2)
C-42	Me	—	i-Bu	CH ₂ (3-CF ₃ -5-Me-Q-2)
C-43	Me	—	CH ₂ -t-Bu	CH ₂ (3-CF ₃ -5-Me-Q-2)
C-44	Me	—	t-Bu	CH ₂ (3-CF ₃ -5-Me-Q-2)
C-45	Me	—	c-Bu	CH ₂ (3-CF ₃ -5-Me-Q-2)

【0072】

※ ※ 【表3】

化合物No.	R ¹	R ²	XR ³	Q
C-46	Me	—	CCl ₃	CH ₂ (3-CF ₃ -5-Me-Q-2)
C-47	Me	—	2-Me-Ph	CH ₂ (3-CF ₃ -5-Me-Q-2)
C-48	Me	—	3-Me-Ph	CH ₂ (3-CF ₃ -5-Me-Q-2)
C-49	Me	—	4-Me-Ph	CH ₂ (3-CF ₃ -5-Me-Q-2)
C-50	Me	—	2-Cl-Ph	CH ₂ (3-CF ₃ -5-Me-Q-2)
C-51	Me	—	3-Cl-Ph	CH ₂ (3-CF ₃ -5-Me-Q-2)
C-52	Me	—	4-Cl-Ph	CH ₂ (3-CF ₃ -5-Me-Q-2)
C-53	Me	—	-CH=CHCl (cis)	CH ₂ (3-CF ₃ -5-Me-Q-2)
C-54	Me	—	c-Pro	3-CF ₃ -Q-2
C-55	Me	—	i-Pro	3-CF ₃ -Q-2
C-56	Me	—	CF ₃	3-CF ₃ -Q-2
C-57	OMe	—	c-Pro	CH ₂ (3-CF ₃ -5-Me-Q-2)
C-58	OMe	—	i-Pro	CH ₂ (3-CF ₃ -5-Me-Q-2)

39				40
C-59	OMe	—	CF ₃	CH ₂ (3-CF ₃ -5-Me-Q-2)
C-60	Cl	—	c-Pro	CH ₂ (3-CF ₃ -5-Me-Q-2)
C-61	Cl	—	i-Pro	CH ₂ (3-CF ₃ -5-Me-Q-2)
C-62	Cl	—	CF ₃	CH ₂ (3-CF ₃ -5-Me-Q-2)
C-63	Me	—	CF ₃	4-CF ₃ -Q-6
C-64	Me	—	c-Pro	4-CF ₃ -Q-6
C-65	Me	—	i-Pro	4-CF ₃ -Q-6
C-66	Me	—	2,4-F ₂ -Ph	4-CF ₃ -Q-6
C-67	Me	—	1-Me-c-Pro	CH ₂ (3-CF ₃ -5-Me-Q-2)
C-68	Me	—	CF ₂ Cl	CH ₂ (3-CF ₃ -5-Me-Q-2)

【0073】

* * 【表4】

化合物No.	R ¹	R ²	XR ³	Q
C-69	Me	—	-CMe=CH ₂	CH ₂ (3-CF ₃ -5-Me-Q-2)
C-70	Me	—	CHCl ₂	CH ₂ (3-CF ₃ -5-Me-Q-2)
C-71	Me	—	CBr ₃	CH ₂ (3-CF ₃ -5-Me-Q-2)
C-72	Me	—	CF ₃	CH ₂ (3-CF ₃ -Q-2)
C-73	Me	—	CCl ₃	CH ₂ (3-CF ₃ -Q-2)
C-74	Me	—	2,4-Cl ₂ -Ph	CH ₂ (3-CF ₃ -5-Me-Q-2)
C-75	Me	—	c-Pro	3-CF ₃ -5-OMe-Q-2
C-76	Me	—	i-Pro	3-CF ₃ -5-OMe-Q-2
C-77	Me	—	2-Me-c-Pro	3-CF ₃ -Q-2
C-78	Me	—	t-Bu	3-CF ₃ -Q-2
C-79	Me	—	CCl ₃	3-CF ₃ -Q-2
C-80	Me	—	-CH=CMe ₂	3-CF ₃ -Q-2
C-81	Me	—	CHF ₂	CH ₂ (3-CF ₃ -5-Me-Q-2)
C-82	Me	—	2,2,3,3-Me ₄ -c-Pro	CH ₂ (3-CF ₃ -5-Me-Q-2)
C-83	Me	—	CF ₃	3-CF ₃ -5-OMe-Q-2
C-84	OMe	—	c-Pro	CH ₂ (3-CF ₃ -Q-2)
C-85	OMe	—	i-Pro	CH ₂ (3-CF ₃ -Q-2)
C-86	OMe	—	CF ₃	CH ₂ (3-CF ₃ -Q-2)
C-87	Cl	—	c-Pro	CH ₂ (3-CF ₃ -Q-2)
C-88	Cl	—	CF ₃	CH ₂ (3-CF ₃ -Q-2)
C-89	Me	—	CF ₂ Cl	CH ₂ (3-CF ₃ -Q-2)
C-90	Me	—	C ₂ F ₅	CH ₂ (3-CF ₃ -Q-2)
C-91	Me	—	2-Me-c-Pro	CH ₂ (3-CF ₃ -Q-2)

【0074】

※40※ 【表5】

化合物No.	R ¹	R ²	XR ³	Q
C-92	Me	—	t-Bu	CH ₂ (3-CF ₃ -Q-2)
C-93	Cl	—	c-Pro	3-CF ₃ -Q-2
C-94	Cl	—	i-Pro	3-CF ₃ -Q-2
C-95	Cl	—	CF ₃	3-CF ₃ -Q-2
C-96	Cl	—	O-i-Pro	3-CF ₃ -Q-2
C-97	Me	—	1-Me-c-Pro	CH ₂ (3-CF ₃ -Q-2)
C-98	Me	—	Pro	CH ₂ (3-CF ₃ -Q-2)

4 1				4 2
C-99	Me	—	OMe=CH ₂	CH ₂ (3-CF ₃ -Q-2)
C-100	Me	—	t-Pen	CH ₂ (3-CF ₃ -Q-2)
C-101	Me	—	OMe ₂ CH ₂ Cl	CH ₂ (3-CF ₃ -Q-2)
C-102	Me	—	CClMeCH ₂ Cl	CH ₂ (3-CF ₃ -Q-2)
C-103	Me	—	2-F-Ph	CH ₂ (3-CF ₃ -Q-2)
C-104	Me	—	2,4-F ₂ -Ph	CH ₂ (3-CF ₃ -Q-2)
C-105	Me	—	DEt	CH ₂ (3-CF ₃ -Q-2)
C-106	Me	—	CH ₂ CF ₃	CH ₂ (3-CF ₃ -5-Me-Q-2)
C-107	Me	—	CCl=CCl ₂	CH ₂ (3-CF ₃ -5-Me-Q-2)
C-108	Me	—	2,2-Cl ₂ -3-Me-c-Pro	CH ₂ (3-CF ₃ -Q-2)
C-109	Me	—	2-CF ₃ -Ph	CH ₂ (3-CF ₃ -Q-2)
C-110	Me	—	O-t-Bu	CH ₂ (3-CF ₃ -Q-2)
C-111	Me	—	NMe ₂	CH ₂ (3-CF ₃ -Q-2)
C-112	Me	—	NHMe	CH ₂ (3-CF ₃ -Q-2)
C-113	Me	—	CHClMe	CH ₂ (3-CF ₃ -5-Me-Q-2)
C-114	Me	—	CCF ₃ =CH ₂	CH ₂ (3-CF ₃ -5-Me-Q-2)

【0075】

* * 【表6】

化合物No.	R ¹	R ²	XR ³	Q
C-115	Me	—	OMe ₂ CHCl ₂	CH ₂ (3-CF ₃ -5-Me-Q-2)
C-116	Me	—	OMe(CH ₂ Cl) ₂	CH ₂ (3-CF ₃ -5-Me-Q-2)
C-117	Me	—	CF ₂ CF ₂ CF ₃	CH ₂ (3-CF ₃ -Q-2)
C-118	Me	—	OMe	CH ₂ (3-CF ₃ -Q-2)
C-119	Me	—	O-i-Pro	CH ₂ (3-CF ₃ -Q-2)
C-120	OMe	—	CF ₂ Cl	CH ₂ (3-CF ₃ -Q-2)
C-121	Me	—	CF ₂ Cl	3-CF ₃ -Q-2
C-122	Me	—	s-Bu	CH ₂ (3-CF ₃ -5-Me-Q-2)
C-123	Me	—	CHMeOMe	CH ₂ (3-CF ₃ -5-Me-Q-2)
C-124	OMe	—	c-Pro	3-CF ₃ -Q-2
C-125	OMe	—	i-Pro	3-CF ₃ -Q-2
C-126	OMe	—	-CH=CM ₂	3-CF ₃ -Q-2
C-127	OMe	—	CF ₃	3-CF ₃ -Q-2
C-128	OMe	—	CCl ₃	3-CF ₃ -Q-2
C-129	OMe	—	CBr ₃	3-CF ₃ -Q-2
C-130	Me	—	-CCl=CH ₂	CH ₂ (3-CF ₃ -5-Me-Q-2)
C-131	Me	—	-CH=CHCl (E)	CH ₂ (3-CF ₃ -5-Me-Q-2)
C-132	Me	—	CHFCl	CH ₂ (3-CF ₃ -5-Me-Q-2)
C-133	Me	—	Me	CH ₂ (3-CF ₃ -Q-2)
C-134	Me	—	Et	CH ₂ (3-CF ₃ -Q-2)
C-135	Me	—	Bu	CH ₂ (3-CF ₃ -Q-2)
C-136	Me	—	Pen	CH ₂ (3-CF ₃ -Q-2)
C-137	Me	—	CH ₂ CF ₃	CH ₂ (3-CF ₃ -Q-2)

【0076】

※ ※ 【表7】

化合物No.	R ¹	R ²	XR ³	Q
C-138	Me	—	NEt ₂	CH ₂ (3-CF ₃ -Q-2)

43				44
C-139	Me	—	NMePh	CH ₂ (3-CF ₃ -Q-2)
C-140	Me	—	CF ₂ CF ₂ Cl	CH ₂ (3-CF ₃ -Q-2)
C-141	Me	—	CF ₂ CF ₂ H	CH ₂ (3-CF ₃ -Q-2)
C-142	Me	—	OMe(CF ₃) ₂	CH ₂ (3-CF ₃ -Q-2)
C-143	Me	—	c-Pro	CH ₂ (3-C ₂ F ₅ -Q-2)
C-144	Me	—	i-Pro	CH ₂ (3-C ₂ F ₅ -Q-2)
C-145	Me	—	CF ₃	CH ₂ (3-C ₂ F ₅ -Q-2)
C-146	Me	—	CF ₂ Cl	CH ₂ (3-C ₂ F ₅ -Q-2)
C-147	OMe	—	2-Me-c-Pro	CH ₂ (3-CF ₃ -Q-2)
C-148	OMe	—	t-Bu	CH ₂ (3-CF ₃ -Q-2)
C-149	OMe	—	2,4-F ₂ -Ph	CH ₂ (3-CF ₃ -Q-2)
C-150	OMe	—	CCl ₃	CH ₂ (3-CF ₃ -Q-2)
C-151	OMe	—	C ₂ F ₅	CH ₂ (3-CF ₃ -Q-2)
C-152	OMe	—	OEt	CH ₂ (3-CF ₃ -Q-2)
C-153	OMe	—	CH ₂ CF ₃	CH ₂ (3-CF ₃ -Q-2)
C-154	OMe	—	1-Me-c-Pro	CH ₂ (3-CF ₃ -Q-2)
C-155	OMe	—	OMe=CH ₂	CH ₂ (3-CF ₃ -Q-2)
C-156	Cl	—	t-Bu	CH ₂ (3-CF ₃ -Q-2)
C-157	Cl	—	CCl ₃	CH ₂ (3-CF ₃ -Q-2)
C-158	Cl	—	CF ₂ Cl	CH ₂ (3-CF ₃ -Q-2)
C-159	Cl	—	2-Me-c-Pro	CH ₂ (3-CF ₃ -Q-2)
C-160	Cl	—	1-Me-c-Pro	CH ₂ (3-CF ₃ -Q-2)

【0077】

* * 【表8】

化合物No.	R ¹	R ²	XR ³	Q
C-161	Cl	—	OMe=CH ₂	CH ₂ (3-CF ₃ -Q-2)
C-162	Cl	—	2,4-F ₂ -Ph	CH ₂ (3-CF ₃ -Q-2)
C-163	Cl	—	OEt	CH ₂ (3-CF ₃ -Q-2)
C-164	Me	—	OCH ₂ CCl ₃	CH ₂ (3-CF ₃ -Q-2)
C-165	Cl	—	CH ₂ CF ₃	CH ₂ (3-CF ₃ -Q-2)
C-166	Cl	—	CF ₂ CF ₃	CH ₂ (3-CF ₃ -Q-2)
C-167	Me	—	CH=CHCF ₃ (E)	CH ₂ (3-CF ₃ -Q-2)
C-168	Me	—	CF ₂ Br	CH ₂ (3-CF ₃ -Q-2)

【0078】〔表1-b〕

※【表9】

【0079】

※

化合物No.	R ¹	R ²	XR ³	A	Q
(A≠Hの場合)					
D-1	Me	—	c-Pro	-CO-c-Pro	CH ₂ (3-CF ₃ -Q-2)
D-2	Me	—	c-Pro	-CO-i-Pro	CH ₂ (3-CF ₃ -Q-2)
D-3	Me	—	c-Pro	-CO-Me	CH ₂ (3-CF ₃ -Q-2)
D-4	Me	—	Et	-CO-c-Pro	CH ₂ (3-CF ₃ -Q-2)
D-5	Me	—	Pro	-CO-c-Pro	CH ₂ (3-CF ₃ -Q-2)
D-6	Me	—	i-Pro	-CO-i-Pro	CH ₂ (3-CF ₃ -Q-2)
D-7	Me	—	c-Pro	-CO-c-Pro	3-CF ₃ -Q-2
D-8	Me	—	Ph	-CO-c-Pro	CH ₂ (3-CF ₃ -Q-2)

(24)

特開平10-72434

45					46
D-9	Me	—	c-Pro	-CO-c-Pro	CH ₂ (3-CF ₃ -5-Me-Q-2)
D-10	Me	—	2-Me-Ph	-CO-c-Pro	CH ₂ (3-CF ₃ -Q-2)
D-11	Me	—	3-Me-Ph	-CO-c-Pro	CH ₂ (3-CF ₃ -Q-2)
D-12	Me	—	4-Me-Ph	-CO-c-Pro	CH ₂ (3-CF ₃ -Q-2)
D-13	Me	—	2-Cl-Ph	-CO-c-Pro	CH ₂ (3-CF ₃ -Q-2)
D-14	Me	—	3-Cl-Ph	-CO-c-Pro	CH ₂ (3-CF ₃ -Q-2)
D-15	Me	—	4-Cl-Ph	-CO-c-Pro	CH ₂ (3-CF ₃ -Q-2)
D-16	Me	—	c-Pro	-CO-Bu	CH ₂ (3-CF ₃ -Q-2)
D-17	Me	—	c-Pro	-CO-t-Bu	CH ₂ (3-CF ₃ -Q-2)
D-18	Me	—	c-Pro	-CO ₂ Me	CH ₂ (3-CF ₃ -Q-2)
D-19	Me	—	c-Pro	-COPen	CH ₂ (3-CF ₃ -Q-2)
D-20	Me	—	c-Pro	-CO-2-Me-c-Pro	CH ₂ (3-CF ₃ -Q-2)

【0080】

* * 【表10】

化合物No.	R ¹	R ²	XR ³	A	Q
D-21	Me	—	c-Pro	-CO-1-Me-c-Pro	CH ₂ (3-CF ₃ -Q-2)
D-22	Me	—	NMe ₂	-CO-c-Pro	CH ₂ (3-CF ₃ -Q-2)
D-23	Me	—	4-OMe-Ph	-CO-c-Pro	CH ₂ (3-CF ₃ -Q-2)
D-24	Me	—	4-NO ₂ -Ph	-CO-c-Pro	CH ₂ (3-CF ₃ -Q-2)
D-25	Cl	—	c-Pro	-CO-c-Pro	CH ₂ (3-CF ₃ -Q-2)
D-26	MeO	—	c-Pro	-CO-c-Pro	CH ₂ (3-CF ₃ -Q-2)
D-27	Me	—	4-CF ₃ -Ph	-CO-c-Pro	CH ₂ (3-CF ₃ -Q-2)
D-28	Me	—	4-CN-Ph	-CO-c-Pro	CH ₂ (3-CF ₃ -Q-2)
D-29	Me	—	4-F-Ph	-CO-c-Pro	CH ₂ (3-CF ₃ -Q-2)

【0081】〔表2-a〕

※【表11】

【0082】

※

化合物 No.	物理的性質
C-1	融点 117-119°C
C-2	融点 133-136°C
C-3	融点 139-141°C
C-4	融点 142-143°C
C-5	融点 130-131°C
C-6	融点 106-108°C
C-7	融点 164-166°C
C-8	融点 125-128°C
C-9	融点 113-115°C
C-10	融点 119-121°C
C-11	融点 158-160°C
C-12	融点 134-135°C
C-13	融点 192-193°C
C-14	融点 193-194°C
C-15	融点 147-148°C
C-16	融点 137-138°C
C-17	融点 86- 88°C
C-18	融点 77- 78°C

(25)

特開平10-72434

47

48

C-19

融点 135-139°C

C-20

融点 139-142°C

C-21

融点 139-141°C

【0083】

* * 【表12】

化合物 No.	物理的性質
C-22	融点 151-153°C
C-23	融点 135-137°C
C-24	融点 214-215°C
C-25	融点 159-162°C
C-26	融点 122-123°C
C-27	融点 184-186°C
C-28	融点 98-100°C
C-29	融点 133-135°C
C-30	融点 98-100°C
C-31	融点 144-148°C
C-32	融点 127-128°C
C-33	融点 143-145°C
C-34	粘稠液体 $^1\text{H-NMR}$ δ (ppm): 1.93(d, 3H, J=7Hz), 2.28(s, 3H), 5.59(t, 1H, J=7Hz), (CDCl_3) 6.32(s, 1H), 6.75-7.45(m, 4H), 7.70-8.19(m, 2H), 9.50(m, 1H)
C-35	融点 170-171°C
C-36	100-101°C
C-37	粘稠液体 $^1\text{H-NMR}$ δ (ppm): 1.27(d, 6H, J=6.8Hz), 1.93(d, 3H, J=7Hz), 2.40-2.90 (CDCl_3) (m, 1H), 5.50(t, 1H, J=7Hz), 6.34(s, 1H), 7.09-7.36 (m, 2H), 7.83-8.11(m, 1H), 9.70(br s, 1H)

【0084】

※ ※ 【表13】

化合物 No.	物理的性質
C-38	粘稠液体 $^1\text{H-NMR}$ δ (ppm): 1.93(d, 3H, J=7Hz), 2.44(s, 3H), 5.46(t, 1H, J=7Hz), (CDCl_3) 7.26-7.60(m, 2H), 7.90-8.14(m, 1H), 11.75(br s, 1H)
C-39	粘稠液体 $^1\text{H-NMR}$ δ (ppm): 2.34(s, 3H), 2.45(s, 3H), 5.13(s, 2H), 6.29(s, 1H), (CDCl_3) 7.10-7.30(m, 2H), 7.75-8.00(m, 1H), 11.38(br s, 1H)
C-40	融点 115-117°C
C-41	融点 138-139°C
C-42	融点 99-100°C
C-43	融点 138-139°C
C-44	融点 133-135°C
C-45	融点 117-120°C
C-46	融点 114-115°C
C-47	融点 132-133°C
C-48	融点 145-146°C

(26)

特開平10-72434

49

50

C-49	融点	185-186°C
C-50	融点	134-137°C
C-51	融点	147-150°C
C-52	融点	191-194°C
C-53	融点	121-124°C
C-54	融点	110-111°C
C-55	融点	101-102°C
C-56	融点	131-132°C

【0085】

* 10 * 【表14】

化合物 No.	物理的性質
C-57	融点 125-128°C
C-58	融点 129-130°C
C-59	融点 117-118°C
C-60	融点 138-139°C
C-61	融点 125-126°C
C-62	融点 118-119°C
C-63	融点 171-172°C
C-64	融点 260-261°C
C-65	融点 239-240°C
C-66	融点 205-206°C
C-67	融点 146-149°C
C-68	融点 107-109°C
C-69	融点 127-132°C
C-70	融点 119-121°C
C-71	融点 123-126°C
C-72	融点 163-165°C
C-73	融点 121-123°C
C-74	融点 151-152°C
C-75	融点 113-115°C
C-76	融点 91- 96°C
C-77	融点 113-114°C
C-78	融点 64- 65°C
C-79	融点 116-117°C

【0086】

※ ※ 【表15】

化合物 No.	物理的性質
C-80	融点 95- 96°C
C-81	融点 140-143°C
C-82	融点 150-153°C
C-83	融点 97- 99°C
C-84	融点 166-167°C
C-85	融点 122-123°C
C-86	融点 139-140°C
C-87	融点 143-144°C
C-88	粘稠液体

(27)

特開平10-72434

51

52

$^1\text{H-NMR}$ δ (ppm): 5.25(s, 2H), 6.37-6.63(m, 1H), 7.10-8.00(m, 4H),
(CDCl_3) 11.21(br s, 1H)

C-89	融点 144-145°C
C-90	融点 110-111°C
C-91	融点 148-149°C
C-92	融点 132-133°C
C-93	融点 109-111°C
C-94	融点 79-81°C
C-95	融点 107-109°C
C-96	融点 69-72°C
C-97	融点 170-171°C
C-98	融点 104-105°C
C-99	融点 155-156°C
C-100	融点 159-160°C

【0087】

* * 【表16】

化合物 No.	物理的性質
C-101	融点 123-124°C
C-102	融点 93-94°C
C-103	融点 126-127°C
C-104	融点 120-121°C
C-105	融点 112-113°C
C-106	融点 150-152°C
C-107	融点 130-132°C
C-108	融点 111-112°C
C-109	融点 136-137°C
C-110	融点 89-90°C
C-111	融点 167-168°C
C-112	融点 173-174°C
C-113	融点 99-101°C
C-114	融点 95-96°C
C-115	粘稠液体
$^1\text{H-NMR}$ δ (ppm): 1.60(s, 6H), 2.27(s, 3H), 2.40(s, 3H), 5.06(s, 2H), (CDCl_3) 6.21(s, 1H), 6.29(s, 1H), 6.90-7.29(m, 2H), 7.46-7.74(m, 1H), 9.26(br s, 1H)	
C-116	粘稠液体
$^1\text{H-NMR}$ δ (ppm): 1.59(s, 3H), 2.28(s, 3H), 2.42(s, 3H), 3.96(s, 4H), (CDCl_3) 5.14(s, 2H), 6.24(s, 1H), 6.88-7.35(m, 2H), 7.41-7.85(m, 1H), 9.88(br s, 1H)	

【0088】

※ ※ 【表17】

化合物 No.	物理的性質
C-117	粘稠液体
$^1\text{H-NMR}$ δ (ppm): 2.30(s, 3H), 5.12(s, 2H), 6.34-6.48(m, 1H), (CDCl_3) 6.97-7.25(m, 2H), 7.42-7.80(m, 2H), 11.20(br s, 1H)	
C-118	融点 104-105°C

(28)

特開平10-72434

53

54

C-119	融点 129-130°C
C-120	融点 106-107°C
C-121	融点 110-111°C
C-122	融点 108-110°C
C-123	融点 88- 91°C
C-124	融点 136-138°C
C-125	融点 95- 96°C
C-126	融点 113-115°C
C-127	融点 134-137°C
C-128	融点 124-126°C
C-129	融点 110-112°C
C-130	融点 131-132°C
C-131	融点 149-151°C
C-132	融点 107-109°C
C-133	融点 133-134°C
C-134	融点 118-119°C
C-135	融点 98- 99°C
C-136	融点 94- 95°C
C-137	融点 158-159°C

【0089】

* * 【表18】

化合物 No.	物理的性質
C-138	融点 124-125°C
C-139	融点 81- 83°C
C-140	融点 68- 69°C
C-141	融点 87- 88°C
C-142	粘稠液体
	¹ H-NMR δ (ppm): 1.88(3H, s), 2.32(3H, s), 5.14(2H, s), (CDCl ₃) 6.51(1H, d, J=2Hz), 7.03-7.33(2H, m), 7.45-7.70(2H, m), 9.91(1H, br s)
C-143	融点 135-136°C
C-144	融点 147-148°C
C-145	融点 90- 91°C
C-146	融点 90- 91°C
C-147	融点 175-177°C
C-148	融点 103-105°C
C-149	融点 117-119°C
C-150	融点 109-111°C
C-151	融点 86- 88°C
C-152	融点 140-142°C
C-153	融点 134-136°C
C-154	融点 176-178°C
C-155	融点 150-152°C
C-156	融点 137-140°C
C-157	融点 108-111°C

【0090】

※ ※ 【表19】

55
化合物 No.

56

物理的性質

C-158	融点 107-110°C
C-159	融点 148-150°C
C-160	融点 139-141°C
C-161	融点 137-139°C
C-162	融点 144-146°C
C-163	融点 106-108°C
C-164	融点 112-113°C
C-165	融点 140-143°C
C-166	融点 80- 82°C
C-167	融点 172-174°C
C-168	融点 119-121°C

【0091】〔表2-b〕

*【表20】

【0092】

*

化合物 No.

物理的性質

D-1	融点 122-123°C
D-2	融点 127-128°C
D-3	融点 70- 71°C
D-4	融点 110-111°C
D-5	融点 83- 84°C
D-6	融点 71- 72°C
D-7	融点 88- 89°C
D-8	粘稠液体
	¹ H-NMR δ (ppm): 0.58-1.78(5H, m), 2.34(3H, s), 5.31(2H, s), (CDCl ₃) 6.53(1H, d, J=2.2Hz), 6.98-7.95(9H, m)
D-9	融点 138-140°C
D-10	融点 129-131°C
D-11	融点 133-134°C
D-12	融点 119-120°C
D-13	粘稠液体
	¹ H-NMR δ (ppm): 0.50-1.59(5H, m), 2.35(3H, s), 5.38(2H, s), (CDCl ₃) 6.55(1H, d, J=2.3Hz), 7.01-7.61(8H, m)
D-14	粘稠液体
	¹ H-NMR δ (ppm): 0.50-1.62(5H, m), 2.36(3H, s), 5.28(2H, s), (CDCl ₃) 6.55(1H, d, J=2.5Hz), 7.03-7.90(8H, m)

【0093】

※ ※【表21】

化合物 No.

物理的性質

D-15	粘稠液体
	¹ H-NMR δ (ppm): 0.50-1.53(5H, m), 2.34(3H, s), 5.26(2H, s), (CDCl ₃) 6.52(1H, d, J=2.3Hz), 7.00-7.89(8H, m)
D-16	粘稠液体
	¹ H-NMR δ (ppm): 0.52-1.95(12H, m), 2.37(3H, s), (CDCl ₃) 2.56-2.89(2H, m), 5.17(2H, s),

57

58

6.52(1H, d, J=2.3Hz), 6.93-7.50(4H, m)

D-17

粘稠液体

 $^1\text{H-NMR } \delta \text{ (ppm): } 0.49-1.30(5\text{H, m}), 1.28(9\text{H, s}), 2.28(3\text{H, s}),$
 $(\text{CDCl}_3) \quad 5.25(2\text{H, s}), 6.54(1\text{H, d, J=2.4Hz}),$
 $6.91-7.60(4\text{H, m})$

D-18

融点 93-94°C

D-19

粘稠液体

 $^1\text{H-NMR } \delta \text{ (ppm): } 0.62-1.88(14\text{H, m}), 2.36(3\text{H, s}),$
 $(\text{CDCl}_3) \quad 2.58-2.90(2\text{H, m}), 5.17(2\text{H, s}),$
 $6.52(1\text{H, d, J=2.2Hz}), 6.93-7.49(4\text{H, m})$

D-20

粘稠液体

 $^1\text{H-NMR } \delta \text{ (ppm): } 0.48-2.20(12\text{H, m}), 2.35(3\text{H, s}), 5.19(2\text{H, s}),$
 $(\text{CDCl}_3) \quad 6.52(1\text{H, d, J=2.3Hz}), 6.98-7.51(4\text{H, m})$

D-21

融点 131-132°C

【0094】

* * 【表22】

化合物 No.	物理的性質
D-22	粘稠液体
$^1\text{H-NMR } \delta \text{ (ppm): } 0.51-1.49(5\text{H, m}), 2.31(3\text{H, s}), 3.06(6\text{H, s}),$ $(\text{CDCl}_3) \quad 5.47(2\text{H, s}), 6.52(1\text{H, d, J=2.5Hz}),$ $6.98-7.27(3\text{H, m}), 7.55-7.71(1\text{H, m})$	
D-23	粘稠液体
$^1\text{H-NMR } \delta \text{ (ppm): } 0.53-1.72(5\text{H, m}), 2.26(3\text{H, s}), 3.75(3\text{H, s}),$ $(\text{CDCl}_3) \quad 5.22(2\text{H, s}), 6.45(1\text{H, d, J=2.3Hz}),$ $6.63-7.12(5\text{H, m}), 7.31-7.84(3\text{H, m})$	
D-24	粘稠液体
$^1\text{H-NMR } \delta \text{ (ppm): } 0.51-1.40(5\text{H, m}), 2.37(3\text{H, s}), 5.26(2\text{H, s}),$ $(\text{CDCl}_3) \quad 6.48(1\text{H, d, J=2.7Hz}), 6.97-7.53(4\text{H, m}),$ $7.76-8.32(4\text{H, m})$	
D-25	融点 134-136°C
D-26	融点 111-113°C
D-27	粘稠液体
$^1\text{H-NMR } \delta \text{ (ppm): } 0.51-1.38(5\text{H, m}), 2.33(3\text{H, s}), 5.28(2\text{H, s}),$ $(\text{CDCl}_3) \quad 6.51(1\text{H, d, J=2.5Hz}), 7.04-8.09(8\text{H, m})$	
D-28	粘稠液体
$^1\text{H-NMR } \delta \text{ (ppm): } 0.54-1.38(5\text{H, m}), 2.38(3\text{H, s}), 5.27(2\text{H, s}),$ $(\text{CDCl}_3) \quad 6.53(1\text{H, d, J=2.0Hz}), 7.00-8.08(8\text{H, m})$	
D-29	融点 107-108°C

【0095】但し、表1-a、表1-b中、Meはメチル基、Etはエチル基、Proはノルマルプロピル基、

【0096】

i-Proはイソプロピル基、c-Proはシクロプロ

【化32】

ピル基、Buはノルマルブチル基、i-Buはイソブチ

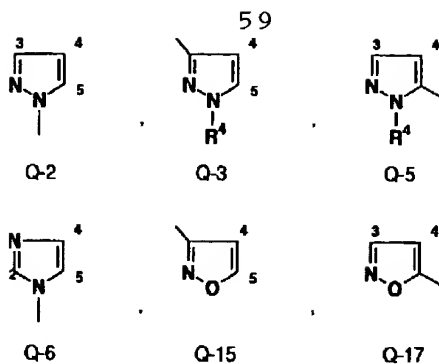
ル基、s-Buはセカンダリーブチル基、t-Buはタ

ーシャリーブチル基、c-Buはシクロブチル基、Pe

nはノルマルペンチル基、t-Penはターシャリーペ

ンチル基、Phはフェニル基を表し、Q-2、Q-3、

Q-5、Q-6、Q-15およびQ-17は下記を表 ※50



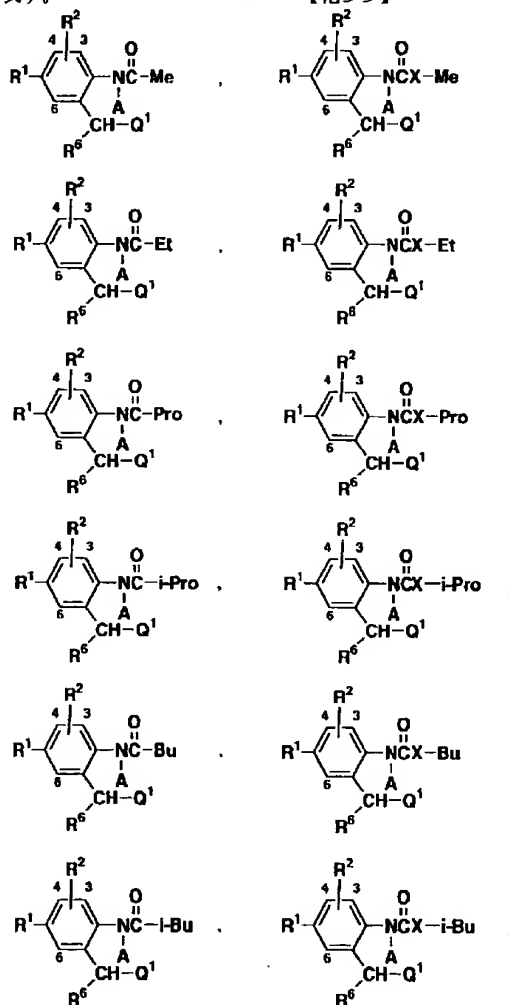
【0097】前記スキームあるいは実施例1～4に準じて合成される本発明化合物の例を、前記実施例化合物も含めて表3および表4に示すが、本発明はこれらによって限定されるものではない。尚、表3および表4中の略号は、それぞれ以下の意味を表す。

* Me:メチル基、Et:エチル基、Pro:ノルマルプロピル基、i-Pro:イソプロピル基、Bu:ノルマルブチル基、i-Bu:イソブチル基、s-Bu:セカンダリーブチル基、t-Bu:ターシャリーブチル基、Pen:ノルマルペンチル基、i-Pen:イソペンチル基、s-Pen:セカンダリーペンチル基、t-Pen:ターシャリーペンチル基、Hex:ノルマルヘキシル基、Hep:ノルマルヘプチル基、c-Pro:シクロプロピル基、c-Bu:シクロブチル基、c-Pen:シクロペンチル基、c-Hex:シクロヘキシル基、c-Hep:シクロヘプチル基、c-Pente:シクロペンテニル基、c-Hexe:シクロヘキセニル基、all:アリル基を表す。

【0098】〔表3〕

【0099】

〔化33〕



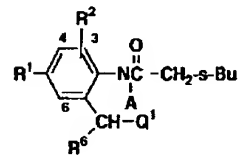
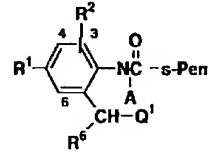
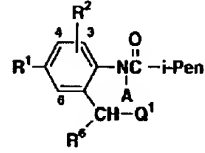
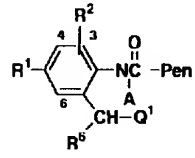
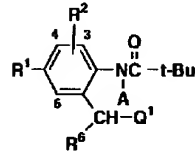
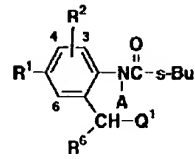
【0100】

※ ※〔化34〕

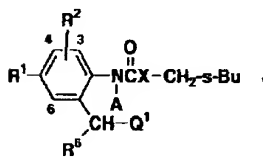
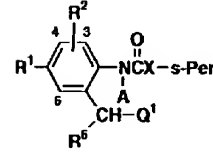
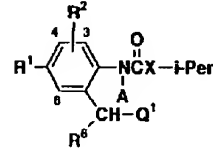
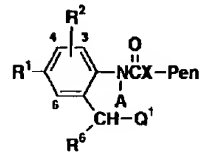
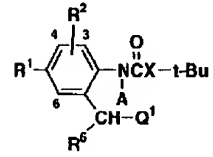
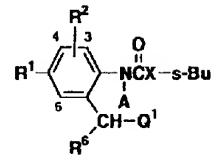
(32)

特開平10-72434

61



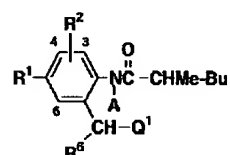
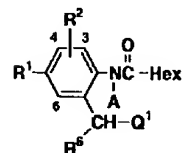
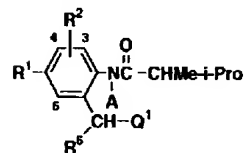
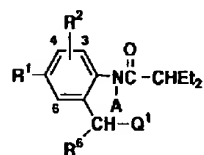
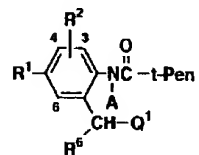
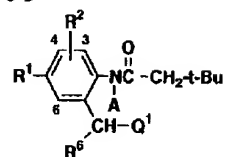
62



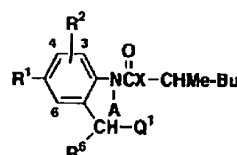
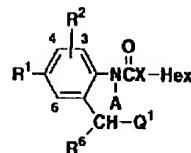
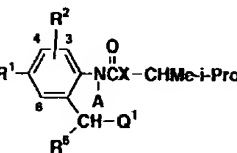
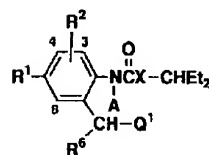
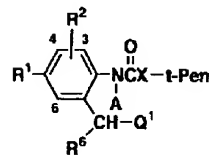
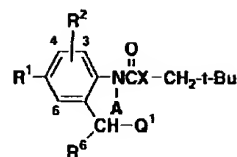
【0101】

* * 【化35】

63



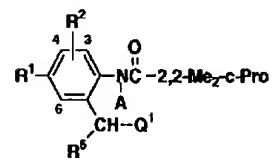
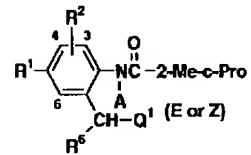
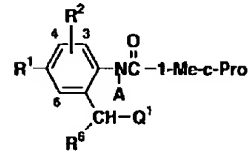
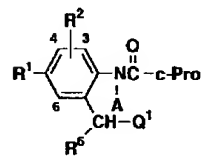
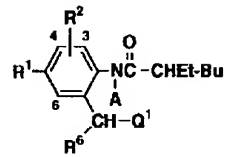
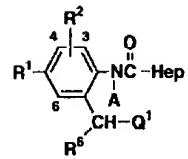
64



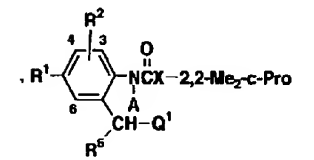
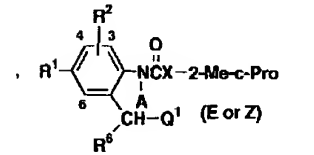
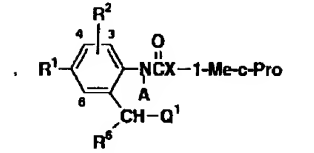
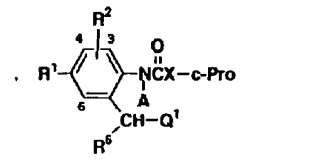
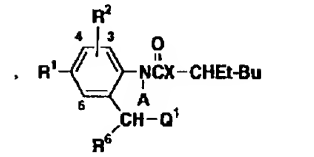
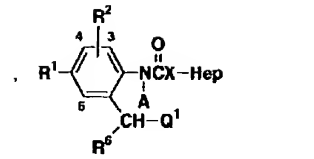
【0102】

* * 【化36】

65



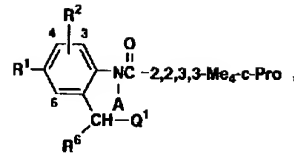
66



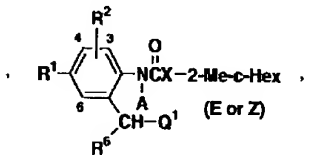
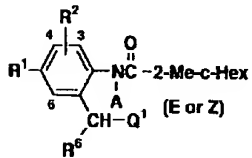
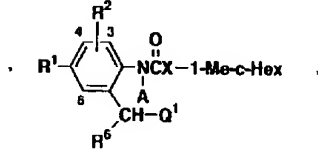
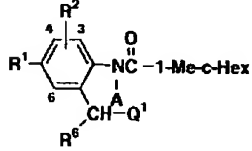
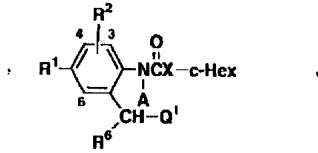
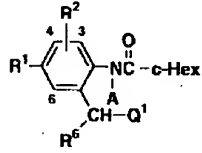
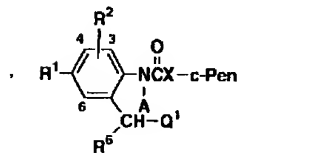
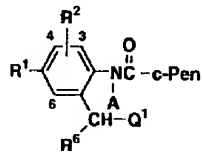
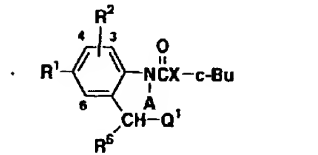
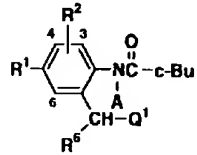
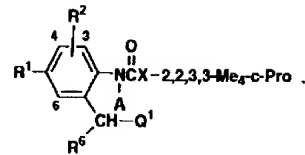
【0103】

* * 【化37】

67



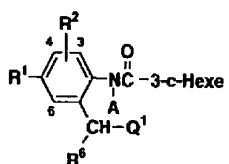
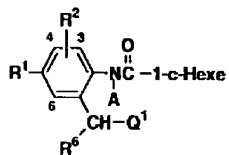
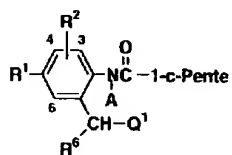
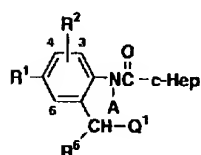
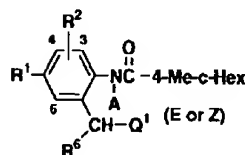
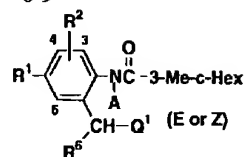
68



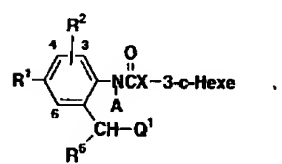
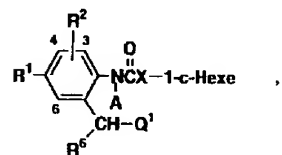
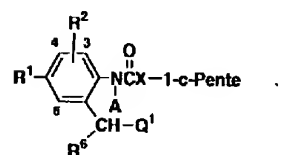
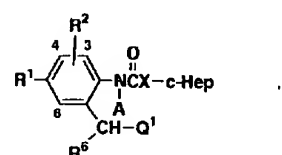
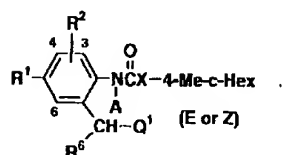
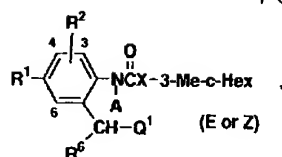
【0104】

* * 【化38】

69



70



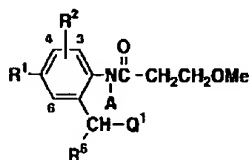
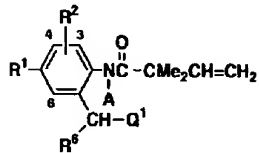
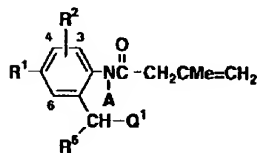
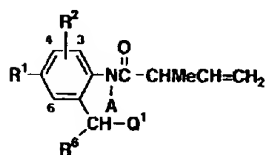
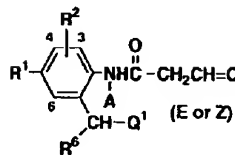
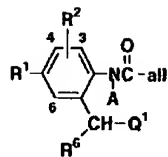
【0105】

* * 【化39】

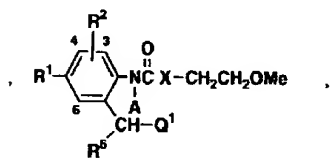
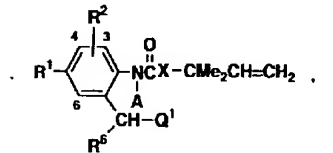
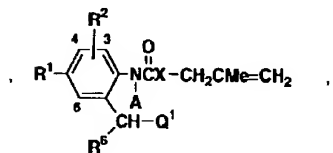
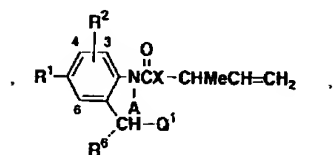
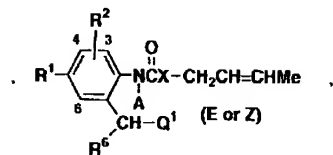
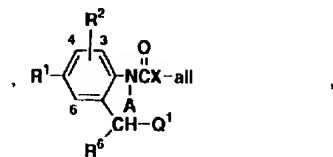
(37)

特開平10-72434

71



72

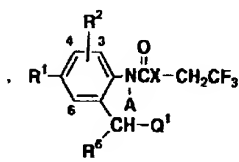
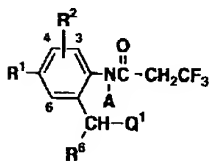
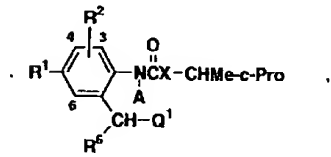
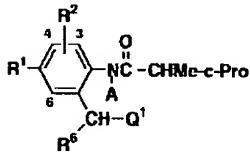
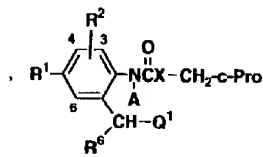
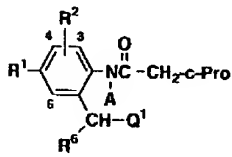
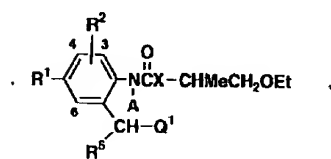
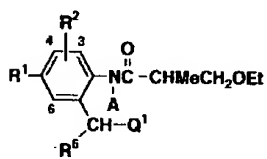
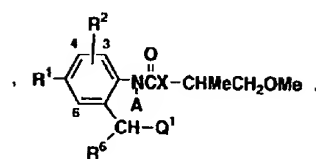
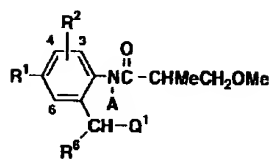
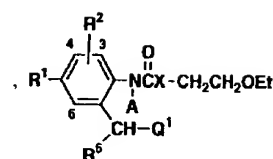
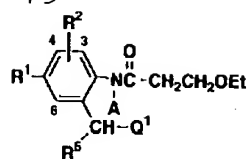


【0106】

* * 【化40】

73

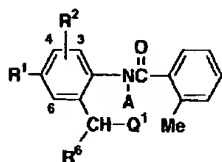
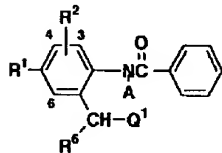
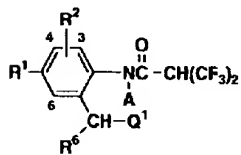
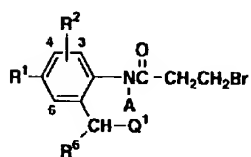
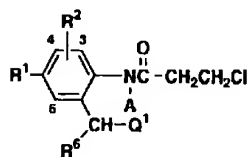
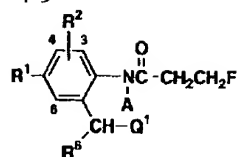
74



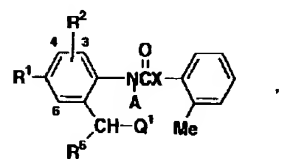
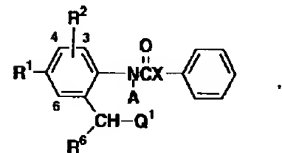
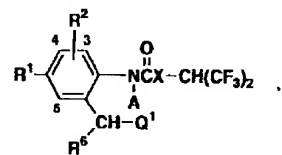
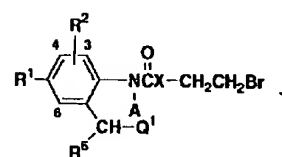
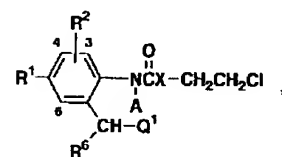
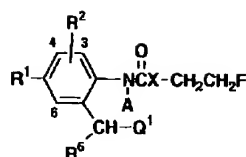
【0107】

* * 【化41】

75



76



【0108】

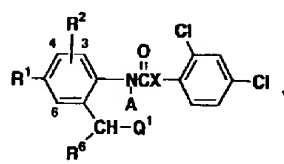
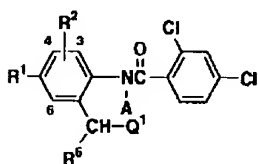
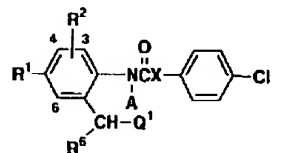
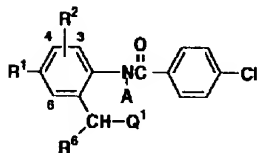
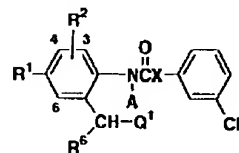
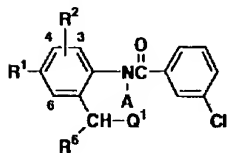
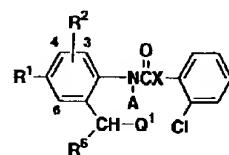
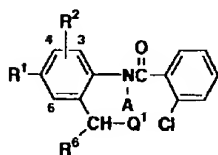
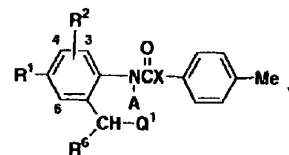
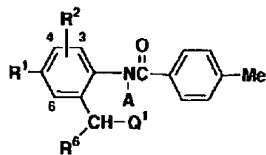
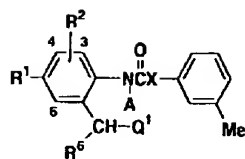
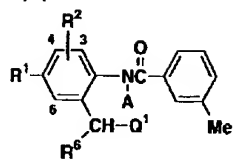
* * 【化42】

(40)

特開平10-72434

77

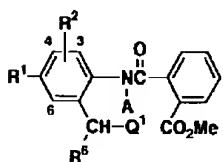
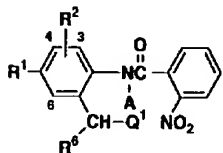
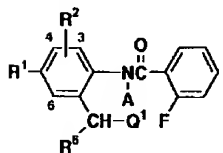
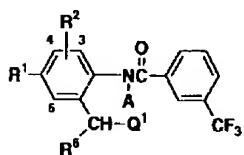
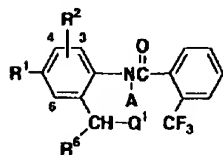
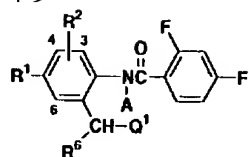
78



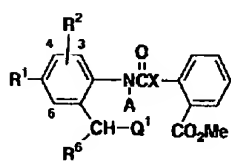
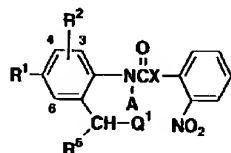
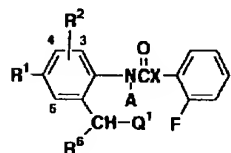
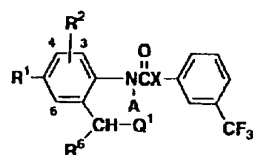
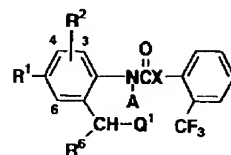
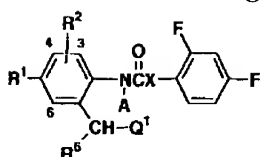
【0109】

* * 【化43】

79



80



【0110】

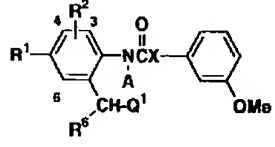
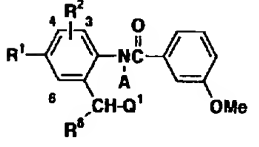
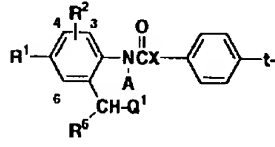
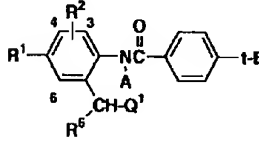
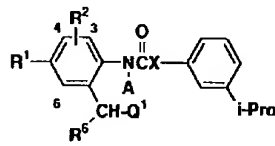
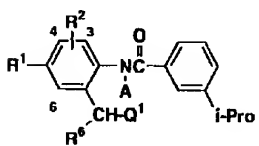
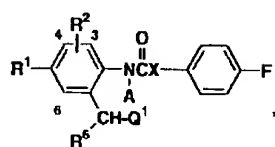
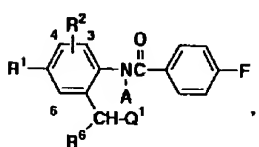
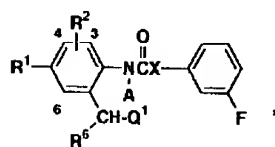
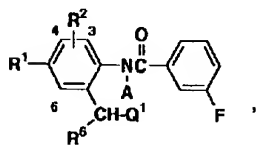
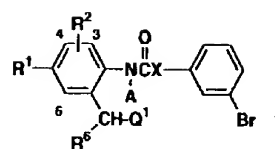
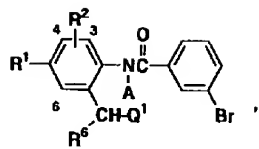
* * 【化44】

(42)

特開平10-72434

81

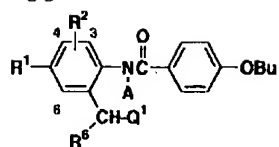
82



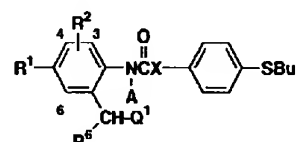
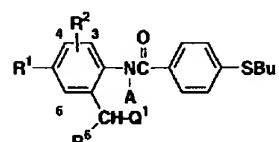
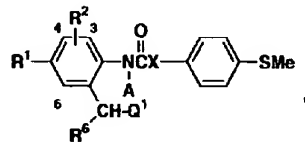
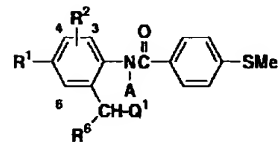
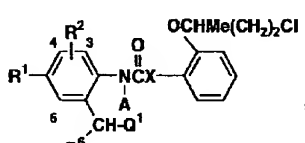
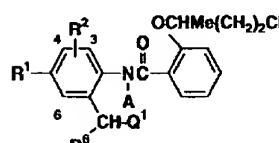
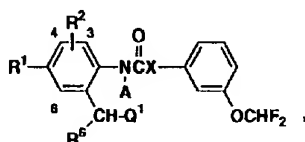
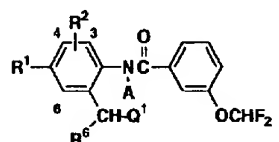
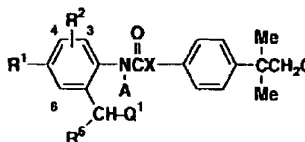
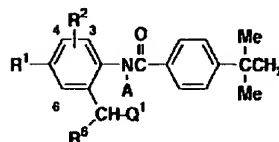
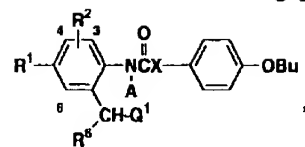
【0111】

* * 【化45】

83



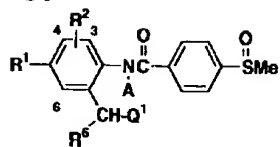
84



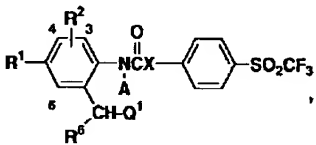
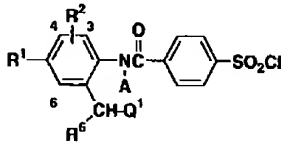
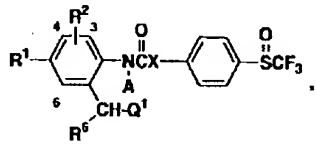
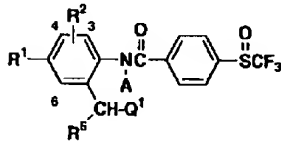
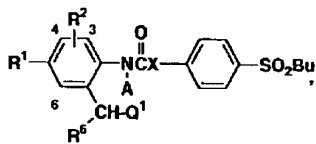
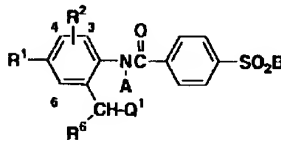
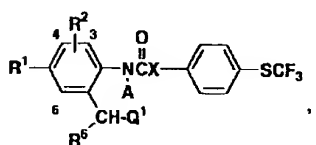
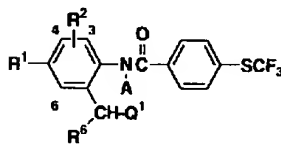
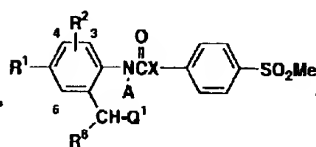
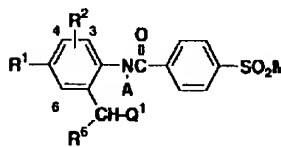
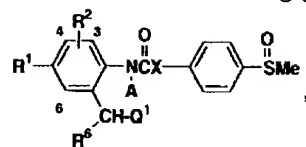
【0112】

* * 【化46】

85



86



【0113】

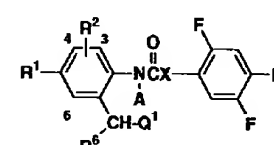
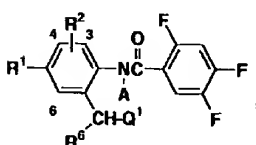
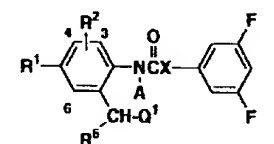
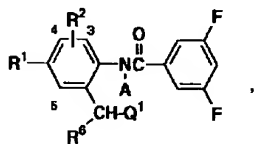
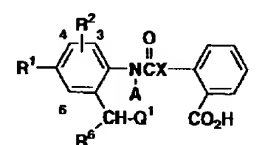
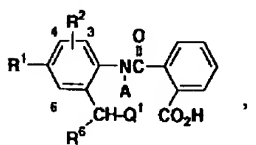
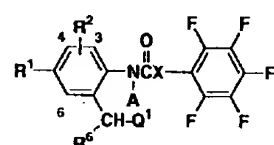
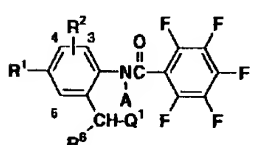
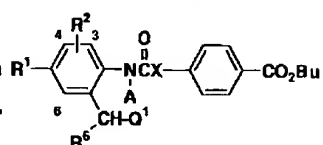
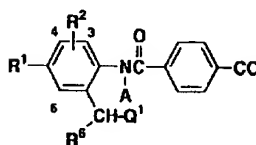
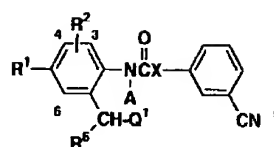
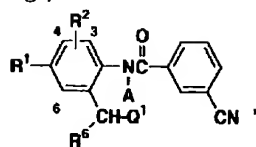
* * 【化47】

(45)

特開平10-72434

87

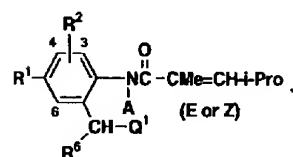
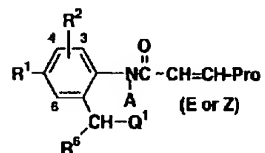
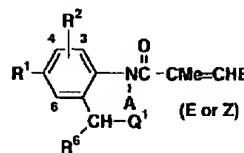
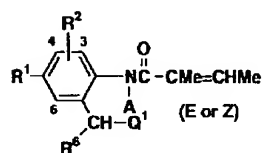
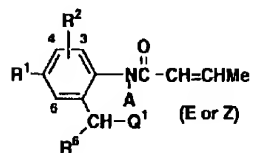
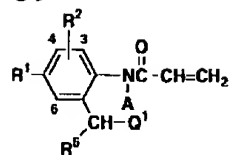
88



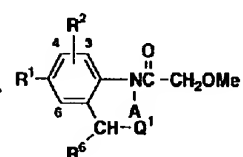
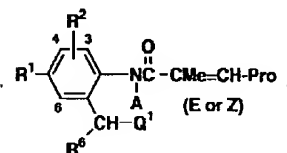
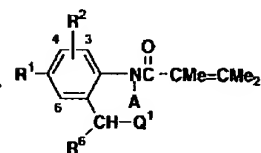
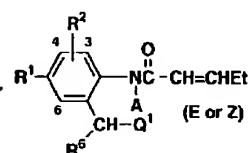
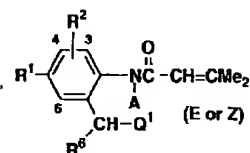
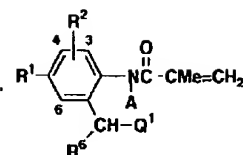
【0114】

* * 【化48】

89



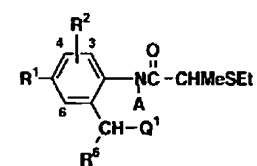
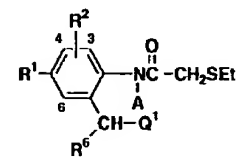
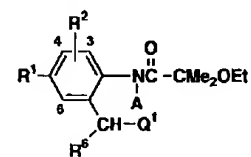
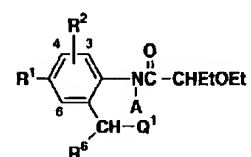
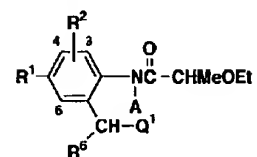
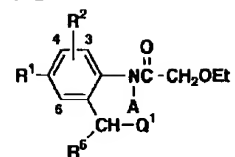
90



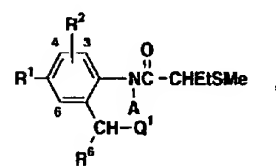
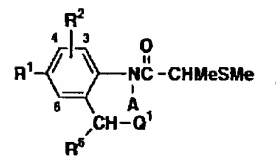
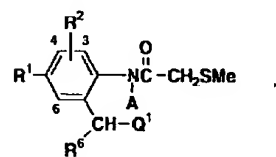
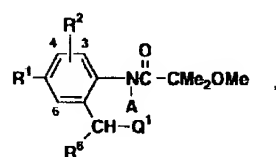
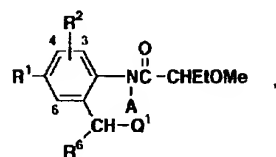
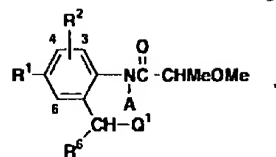
【0115】

* * 【化49】

91



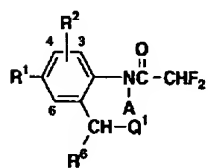
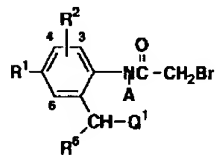
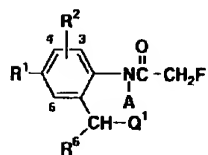
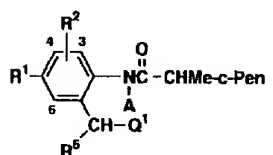
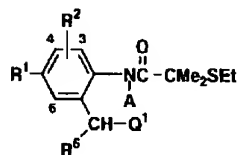
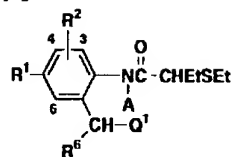
92



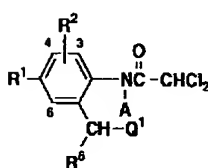
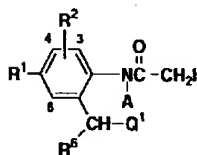
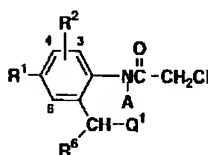
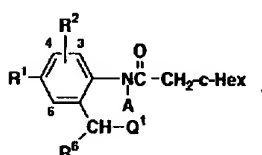
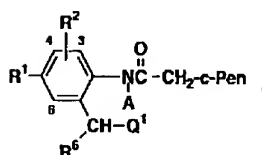
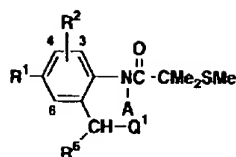
【0116】

* * 【化50】

93



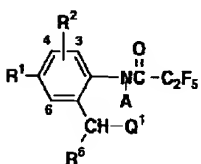
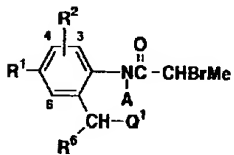
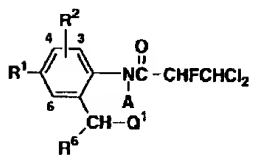
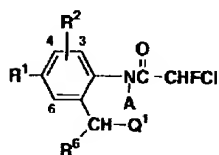
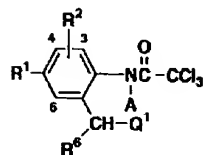
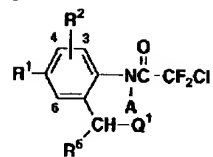
94



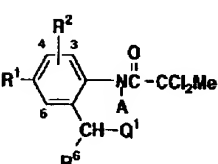
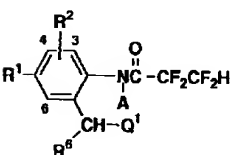
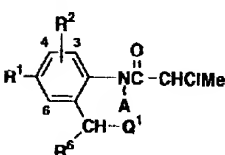
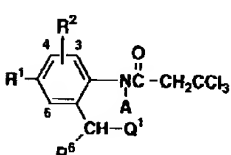
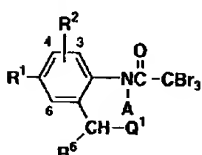
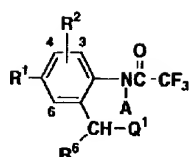
【0117】

* * 【化51】

95



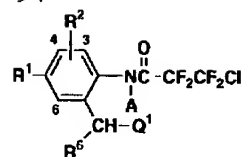
96



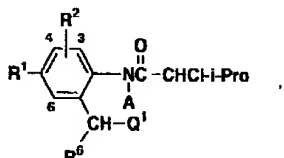
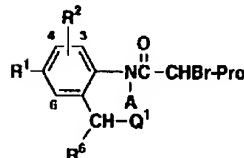
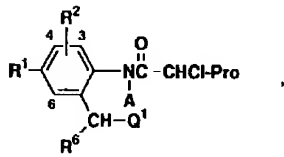
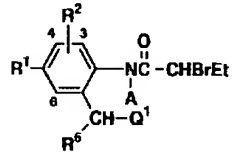
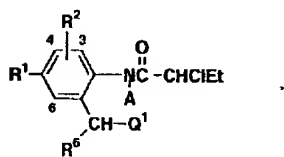
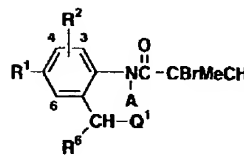
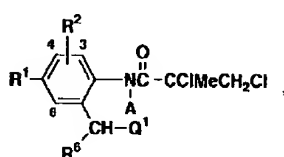
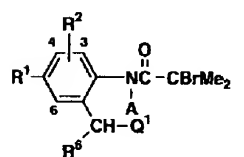
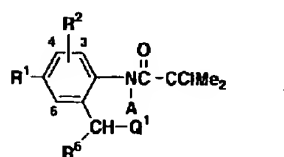
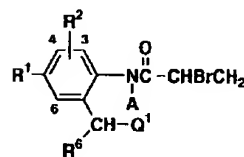
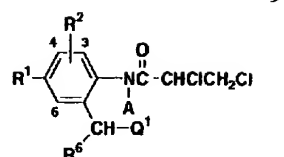
【0118】

* * 【化52】

97



98

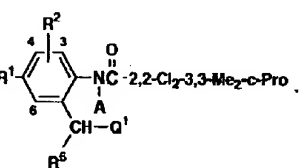
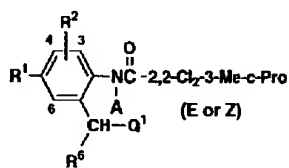
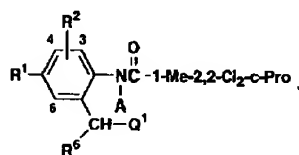
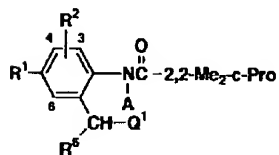
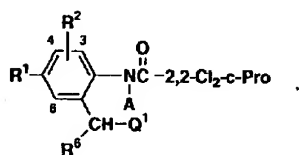
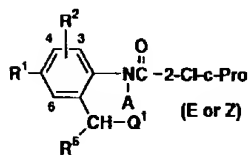
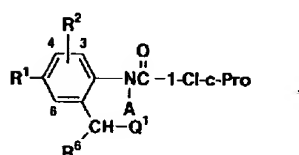
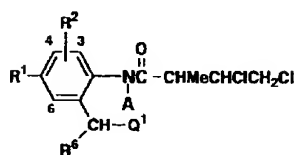
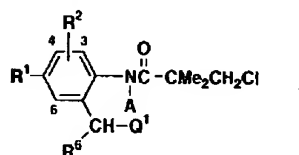
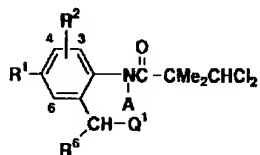
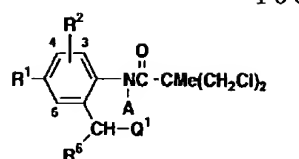
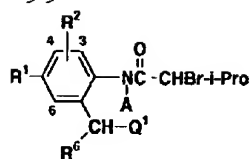


【0119】

* * 【化53】

99

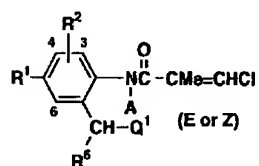
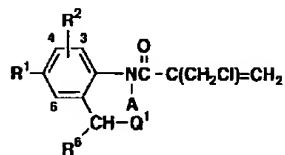
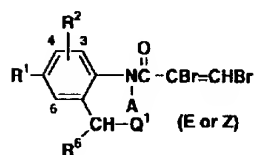
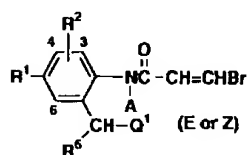
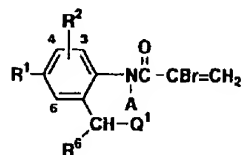
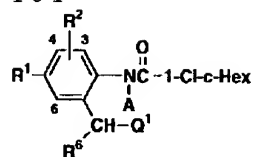
100



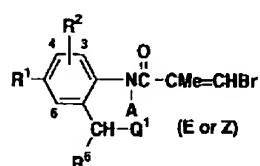
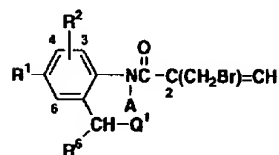
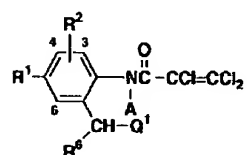
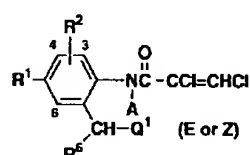
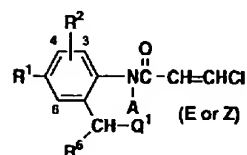
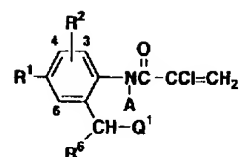
【0120】

* * 【化54】

101



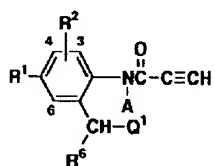
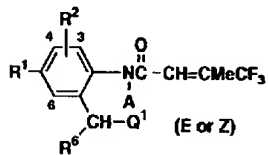
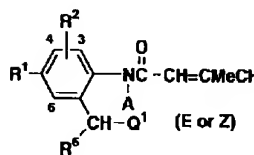
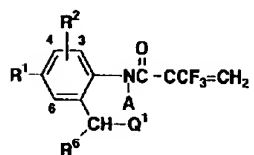
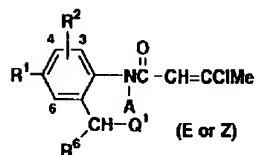
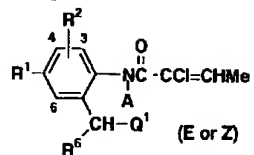
102



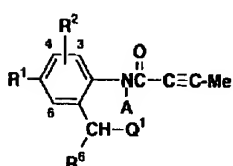
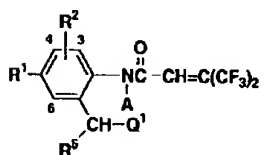
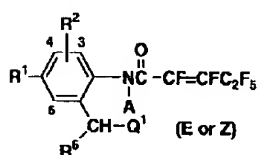
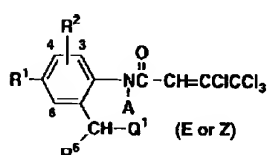
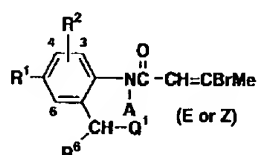
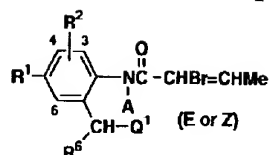
【0121】

* * 【化55】

103



104



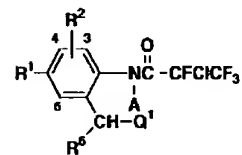
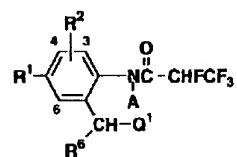
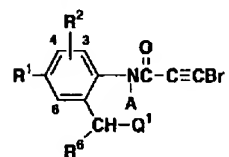
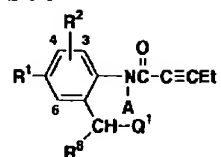
【0122】

* * 【化56】

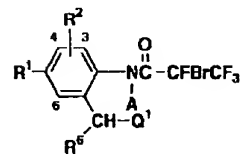
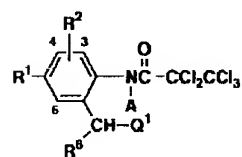
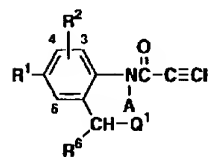
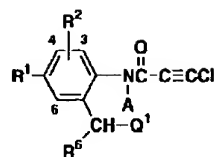
(54)

特開平10-72434

105



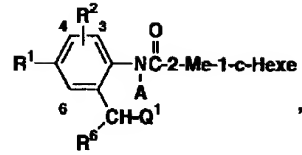
106



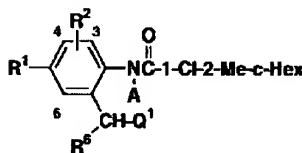
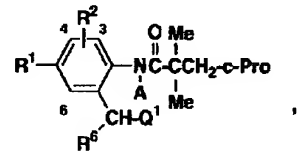
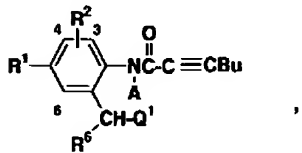
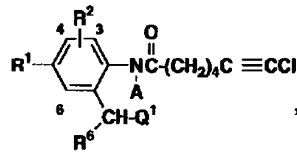
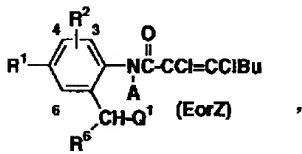
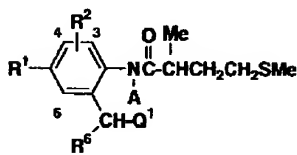
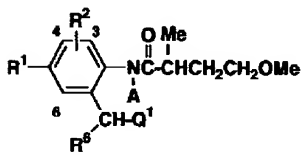
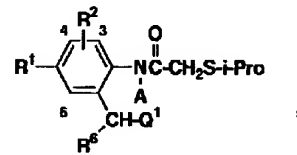
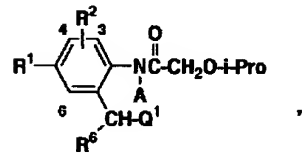
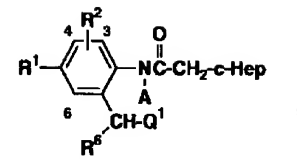
【0123】

* * 【化57】

107



108

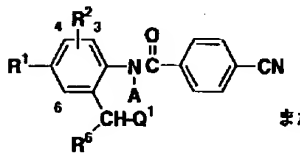
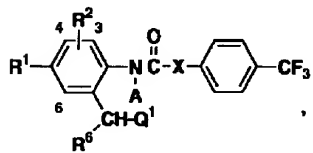
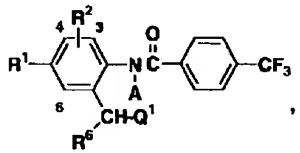
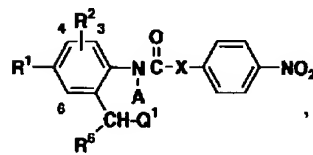
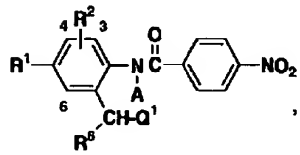
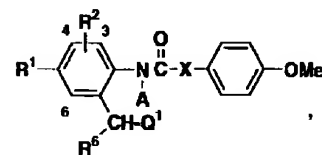
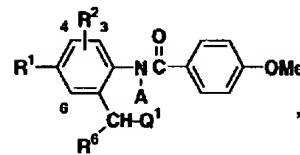
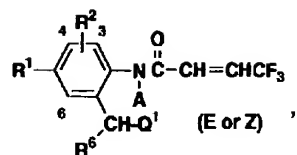
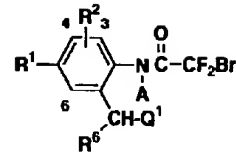


【0124】

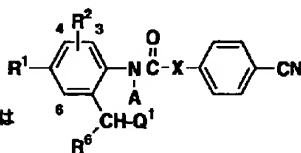
* * 【化58】

109

110



または



【0125】但し、AはH、CHO、MeCO、EtCO、ProCO、i-
-ProCO、BuCO、i-BuCO、s-BuCO、t-BuCO、CF₃CO、CF₂Cl
CO、CCl₃CO、CHCl₂CO、C₂F₅CO、CF₃CH₂CO、MeCHClCO、C
HF₂CF₂CO、CF₂ClCF₂CO、EtCHClCO、i-ProCHBrCO、CO₂M
e、CO₂Et、CO₂Pro、CO₂i-Pro、CO₂Bu、CO₂t-Bu、CO₂CH₂
CF₃、CO₂CH(CF₃)₂、CO₂(CH₂)₄Cl、CH₂=CHCO、CH₂=CMeC
O、MeCH=CHCO(E or Z)、Me₂C=CHCO、C(O)SMe、C(O)SEt、C
(O)SBu、c-ProCO、1-Me-c-ProCO、2-Me-c-ProCO、c-BuCO、
c-PenCO、c-HexCO、CO₂c-Pro、CO₂c-Pen、CO₂c-He *

* x、MeS、EtS、BuS、MeSO、EtSO、BuSO、MeSO₂、EtSO₂、
ProSO₂、BuSO₂、CCl₃S、CF₃S、CF₂ClS、C₂F₅S、CF₃(C
F₂)₃S、CCl₃SO₂、CF₃SO₂、CF₂ClSO₂、C₂F₅SO₂、CF₃(CF₂)₃S
O、CCl₃SO₂、CF₃SO₂、CF₂ClSO₂、C₂F₅SO₂またはCF₃(CF
2)₃SO₂を示し、XはO、S、NH、MeN、EtN、ProNまたはis
o-ProNを示す。

【0126】

【表23】

R ¹	R ²	R ⁶	Q ¹
Me	H	H	3-Cl-Q-2
Me	H	H	3,5-Cl ₂ -Q-2
Me	H	H	3-Cl-5-Me-Q-2
Me	H	H	3,4-Cl ₂ -Q-2
Me	H	H	3,5-Cl ₂ -Q-2
Me	H	H	3,5-Cl ₂ -4-CO ₂ Me-Q-2
Me	H	H	3-Br-Q-2
Me	H	H	4-Cl-Q-2
Me	H	H	3-Me-4-Cl-Q-2
Me	H	H	3-i-Pro-5-Cl-Q-2

(57)

特開平10-72434

111

112

Me	H	H	3-t-Bu-5-Cl-Q-2
Me	H	H	3-CN-Q-2
Me	H	H	3-CN-5-Cl-Q-2
Me	H	H	3-CN-5-Me-Q-2
Me	H	H	3-CN-4-Cl-Q-2
Me	H	H	4-CN-Q-2
Me	H	H	3-Cl-4-NO ₂ -Q-2
Me	H	H	3-CCl ₃ -Q-2
Me	H	H	3-CCl ₃ -5-Cl-Q-2
Me	H	H	3-CCl ₃ -5-Me-Q-2
Me	H	H	3-CCl ₃ -5-Et-Q-2
Me	H	H	3-CF ₂ Cl-Q-2
Me	H	H	3-CF ₂ Cl-5-Cl-Q-2

【0127】

* * 【表24】

R ¹	R ²	R ⁶	Q ¹
Me	H	H	3-CF ₂ Cl-5-Me-Q-2
Me	H	H	3-CF ₂ Cl-5-Et-Q-2
Me	H	H	3-CF ₂ Cl-5-F-Q-2
Me	H	H	3-CF ₃ -Q-2
Me	H	H	3-CF ₃ -5-Cl-Q-2
Me	H	H	3-CF ₃ -5-Me-Q-2
Me	H	H	3-CF ₃ -5-Et-Q-2
Me	H	H	3-CF ₃ -5-F-Q-2
Me	H	H	3-CF ₃ -4-Cl-Q-2
Me	H	H	3-CF ₃ -4-Cl-5-Me-Q-2
Me	H	H	3-CF ₃ -4-NO ₂ -Q-2
Me	H	H	3-CF ₃ -4-Me-Q-2
Me	H	H	3-CF ₃ -5-OMe-Q-2
Me	H	H	3-CF ₃ -4,5-Me ₂ -Q-2
Me	H	H	3-CF ₃ -4-CO ₂ Me-5-Cl-Q-2
Me	H	H	3-CF ₃ -5-Br-Q-2
Me	H	H	3-CF ₃ -4-Br-Q-2
Me	H	H	3,5-(CF ₃) ₂ -Q-2
Me	H	H	3-C ₂ F ₅ -Q-2
Me	H	H	3-C ₂ F ₅ -5-Cl-Q-2
Me	H	H	3-C ₂ F ₅ -5-Me-Q-2
Me	H	H	3-C ₂ F ₅ -5-Et-Q-2
Me	H	H	3-C ₂ F ₅ -5-F-Q-2

【0128】

※ ※ 【表25】

R ¹	R ²	R ⁶	Q ¹
Me	H	H	3-C ₂ F ₅ -4-Cl-5-Me-Q-2
Me	H	H	3-C ₂ F ₅ -4-Cl-Q-2
Me	H	H	3-CF ₃ CH ₂ -Q-2
Me	H	H	3-CF ₃ CH ₂ -5-Cl-Q-2

(58)

特開平10-72434

113

114

Me	H	H	3-CF ₃ CH ₂ -5-Me-Q-2
Me	H	H	3-CF ₃ CH ₂ -5-Et-Q-2
Me	H	H	3-CF ₃ CH ₂ -4-Cl-5-Me-Q-2
Me	H	H	3-OCF ₃ -Q-2
Me	H	H	3-OCF ₃ -5-Cl-Q-2
Me	H	H	3-OCF ₃ -5-Me-Q-2
Me	H	H	3-OCF ₃ -5-Et-Q-2
Me	H	H	3-OCF ₃ -4-Cl-5-Me-Q-2
Me	H	H	3-OCHF ₂ -Q-2
Me	H	H	3-OCHF ₂ -5-Cl-Q-2
Me	H	H	3-OCHF ₂ -5-Me-Q-2
Me	H	H	3-OCHF ₂ -4-Cl-5-Me-Q-2
Me	H	H	3-C ₃ F ₇ -Q-2
Me	H	H	3-C ₃ F ₇ -5-Cl-Q-2
Me	H	H	3-C ₃ F ₇ -5-Me-Q-2
Me	H	H	3-Me-4-NO ₂ -Q-2
Me	H	H	3,5-Me ₂ -4-NO ₂ -Q-2
Me	H	H	3-i-Pro-4-NO ₂ -Q-2
Me	H	H	3-i-Pro-4-Cl-Q-2

【0129】

* * 【表26】

R ¹	R ²	R ⁶	Q ¹
Me	H	H	3-t-Bu-4-NO ₂ -Q-2
Me	H	H	3-t-Bu-4-Cl-Q-2
Me	3-Cl	H	3-CF ₃ -Q-2
Me	3-Cl	H	3-CF ₃ -5-Me-Q-2
Me	3-Me	H	3-CF ₃ -Q-2
Me	3-Me	H	3-CF ₃ -5-Me-Q-2
Me	3-NO ₂	H	3-CF ₃ -Q-2
Me	3-NO ₂	H	3-CF ₃ -5-Me-Q-2
Me	3-OMe	H	3-CF ₃ -Q-2
Me	3-OMe	H	3-CF ₃ -5-Me-Q-2
Me	4-NO ₂	H	3-CF ₃ -Q-2
Me	4-NO ₂	H	3-CF ₃ -5-Me-Q-2
Cl	H	H	3-CF ₃ -Q-2
Cl	H	H	3-CF ₃ -5-Cl-Q-2
Cl	H	H	3-CF ₃ -5-Me-Q-2
Et	H	H	3-CF ₃ -Q-2
Et	H	H	3-CF ₃ -5-Cl-Q-2
Et	H	H	3-CF ₃ -5-Me-Q-2
OMe	H	H	3-CF ₃ -Q-2
OMe	H	H	3-CF ₃ -5-Cl-Q-2
OMe	H	H	3-CF ₃ -5-Me-Q-2
SMe	H	H	3-CF ₃ -Q-2
SMe	H	H	3-CF ₃ -5-Cl-Q-2

【0130】

※ ※ 【表27】

(59)

特開平10-72434

115

116

R ¹	R ²	R ⁶	Q ¹
SMe	H	H	3-CF ₃ -5-Me-Q-2
Me	H	H	5-CF ₃ -Q-3(R ⁴ :H)
Me	H	H	5-CF ₃ -Q-3(R ⁴ :Me)
Me	H	H	5-CF ₃ -4-Cl-Q-3(R ⁴ :Me)
Me	H	H	5-CF ₃ -4-Me-Q-3(R ⁴ :Me)
Cl	H	H	5-CF ₃ -Q-3(R ⁴ :Me)
Me	H	H	3-CF ₃ -5-Me-Q-4(R ⁴ :Me)
Me	H	H	3-CF ₃ -5-Me-Q-4(R ⁴ :H)
Me	H	H	3-Me-5-CF ₃ -Q-4(R ⁴ :Me)
Me	H	H	3-CF ₃ -Q-5(R ⁴ :H)
Me	H	H	3-CF ₃ -Q-5(R ⁴ :Me)
Cl	H	H	3-CF ₃ -Q-5(R ⁴ :Me)
Me	H	H	5-CF ₃ -Q-15
Me	H	H	5-CF ₃ -4-Me-Q-15
Cl	H	H	5-CF ₃ -Q-15
Me	H	H	3-CF ₃ -5-Me-Q-16
Me	H	H	3-Me-5-CF ₃ -Q-16
Me	H	H	3-CF ₃ -Q-17
Me	H	H	3-CF ₃ -4-Me-Q-17
Cl	H	H	3-CF ₃ -Q-17
Cl	H	Me	3-CF ₃ -5-Me-Q-2
Me	H	H	3-Cl-Q-1
Me	H	H	3-CF ₃ -Q-1

【0131】

* * 【表28】

R ¹	R ²	R ⁶	Q ¹
Me	H	H	3-NO ₂ -Q-1
Me	H	H	4-CF ₃ -Q-6
Me	H	H	2-Me-4-CF ₃ -Q-6
Me	H	H	2-Cl-4-CF ₃ -Q-6
Me	H	H	4-CF ₃ -Q-7(R ⁴ :H)
Me	H	H	4-CF ₃ -Q-7(R ⁴ :Me)
Me	H	H	5-CF ₃ -Q-7(R ⁴ :Me)
Me	H	H	2-CF ₃ -Q-8(R ⁴ :H)
Me	H	H	2-CF ₃ -Q-8(R ⁴ :Me)
Me	H	H	2-CF ₃ -5-Me-Q-8(R ⁴ :H)
Me	H	H	2-CF ₃ -5-Me-Q-8(R ⁴ :Me)
Me	H	H	2-CF ₃ -5-Cl-Q-8(R ⁴ :H)
Me	H	H	2-CF ₃ -5-Cl-Q-8(R ⁴ :Me)
Me	H	H	2-CF ₃ -Q-9(R ⁴ :H)
Me	H	H	2-CF ₃ -Q-9(R ⁴ :Me)
Me	H	H	2-CF ₃ -4-Me-Q-9(R ⁴ :H)
Me	H	H	2-CF ₃ -4-Me-Q-9(R ⁴ :Me)
Me	H	H	2-CF ₃ -Q-10
Me	H	H	2-CF ₃ -5-SMe-Q-10
Me	H	H	2-CF ₃ -5-SO ₂ Me-Q-10

(60)

特開平10-72434

117

118

Me	H	H	2,5-Cl ₂ -Q-10
Me	H	H	5-CF ₃ -Q-11(R ⁴ :H)
Me	H	H	5-CF ₃ -Q-11(R ⁴ :Me)

【0132】

* * 【表29】

R ¹	R ²	R ⁶	Q ¹
Me	H	H	5-Cl-Q-11(R ⁴ :H)
Me	H	H	5-Cl-Q-11(R ⁴ :Me)
Me	H	H	3-CF ₃ -Q-12
Me	H	H	3-CF ₃ -4-Me-Q-12
Me	H	H	3-CF ₃ -4-Cl-Q-12
Me	H	H	5-CF ₃ -Q-13(R ⁴ :H)
Me	H	H	5-CF ₃ -Q-13(R ⁴ :Me)
Me	H	H	3-CF ₃ -Q-14(R ⁴ :Me)
Me	H	H	4-CF ₃ -Q-18
Me	H	H	5-CF ₃ -Q-18
Me	H	H	2-CF ₃ -Q-19
Me	H	H	2-CF ₃ -5-Me-Q-19
Me	H	H	2-CF ₃ -Q-20
Me	H	H	2-CF ₃ -4-Me-Q-20
Me	H	H	5-CF ₃ -Q-21
Me	H	H	5-Cl-Q-21
Me	H	H	4-CF ₃ -Q-22
Me	H	H	4-Cl-Q-22
Me	H	H	2-CF ₃ -Q-23
Me	H	H	2-C ₂ F ₅ -Q-23
Me	H	H	5-CF ₃ -Q-24
Me	H	H	3-CF ₃ -Q-25
Me	H	H	3-CF ₃ -Q-26

【0133】

※ ※ 【表30】

R ¹	R ²	R ⁶	Q ¹
Me	H	H	4-CF ₃ -Q-27
Me	H	H	4-CF ₃ -5-Cl-Q-27
Me	H	H	5-CF ₃ -Q-27
Me	H	H	2-CF ₃ -Q-28
Me	H	H	2-CF ₃ -5-Cl-Q-28
Me	H	H	2-CF ₃ -4-Me-Q-29
Me	H	H	2-CF ₃ -Q-29
Me	H	H	5-CF ₃ -Q-30
Me	H	H	5-Cl-Q-30
Me	H	H	5-C ₂ F ₅ -Q-30
Me	H	H	4-CF ₃ -Q-31
Me	H	H	2-CF ₃ -Q-32
t-Bu	H	H	3-CF ₃ -Q-2
CF ₃	H	H	3-CF ₃ -Q-12

(61)

特開平10-72434

119

120

OBu	H	H	4-CF ₃ -Q-18
OCHF ₂	H	H	3-CN-Q-2
SBu	H	H	3-CF ₃ -Q-2
MeOCH ₂	H	H	2-CF ₃ -Q-19
EtOCH ₂	H	H	5-CF ₃ -Q-24
MeO(CH ₂) ₂	H	H	4-CF ₃ -Q-27
MeSCH ₂	H	H	4-CF ₃ -Q-31
MeCO	H	H	3-CF ₃ -Q-2
F	H	H	3-CF ₃ -Q-2

【0134】

* * 【表31】

R ¹	R ²	R ⁶	Q ¹
F	F	H	3-C ₂ F ₅ -Q-2
Br	H	H	3-CHF ₂ -Q-2
NO ₂	H	H	3-CF ₃ -Q-2
CN	H	H	4-Cl-Q-2
Me	3-Pro	H	3-CF ₃ -Q-2
Me	3-CF ₃	H	3-CF ₃ -Q-2
Me	4-O-i-Pro	H	3-CF ₃ -Q-2
Me	4-OCF ₃	H	3-CF ₃ -Q-2
Me	3-Br	H	3-CF ₃ -Q-2
Me	3-CN	H	3-CF ₃ -Q-2
Me	H	Et	3-CF ₃ -Q-2
Me	H	i-Pro	3-CF ₃ -Q-2
Me	H	Bu	3-CF ₃ -Q-2
CN	H	H	3-CF ₃ -Q-2
CN	H	H	3-C ₂ F ₅ -Q-2
CN	H	H	3-Cl-Q-2
CN	H	H	3-CN-Q-2
CN	H	H	3-Br-Q-2
CN	H	H	3-OCF ₃ -Q-2
CN	H	H	3-CF ₃ (CF ₂) ₂ -Q-2
CN	H	H	3-CF ₃ (CF ₂) ₃ -Q-2
CN	H	H	3-OCH ₂ CF ₃ -Q-2
CN	H	H	3-CF ₃ -5-CH ₃ -Q-2

【0135】

※ ※ 【表32】

R ¹	R ²	R ⁶	Q ¹
CN	H	H	3-i-Pr-5-Cl-Q-2
Me	H	H	3-CN-5-CH ₃ -Q-2
Me	H	H	3-CN-5-Cl-Q-2
Me	H	H	3-CN-Q-2
Me	H	H	3-CF ₃ (CF ₂) ₂ -Q-2
Me	H	H	3-CF ₃ -4-CO ₂ Bu-Q-2
Me	H	H	3,5-(C ₂ F ₅) ₂ -Q-2
Me	H	H	3-CF ₃ (CF ₂) ₂ -4-Cl-Q-2

(62)

特開平10-72434

121

Me	H	H	3-CF ₃ -5-OBu-Q-2
Me	H	H	4-Cl-5-OCF ₃ -Q-2
Me	H	H	2-CF ₃ -5-SBu-Q-10
Me	H	H	2-CF ₃ -5-SO ₂ Bu-Q-10
Me	H	H	2-CF ₃ -5-SOMe-Q-10
Me	H	H	2-CF ₃ -5-SOBu-Q-10
Me	H	H	3-CF ₃ -4-SCF ₃ -Q-2
Me	H	H	3-CF ₃ -4-SOCF ₃ -Q-2
Me	H	H	3-CF ₃ -4-SO ₂ CF ₃ -Q-2
Me	H	H	3-CF ₃ -4-S(CF ₃) ₃ -Q-2
Me	H	H	3-CF ₃ -4-SO(CF ₃) ₃ -Q-2
Me	H	H	3-CF ₃ -4-SO ₂ (CF ₃) ₃ -Q-2
Me	H	H	3-CF ₃ -4-CO ₂ H-Q-2

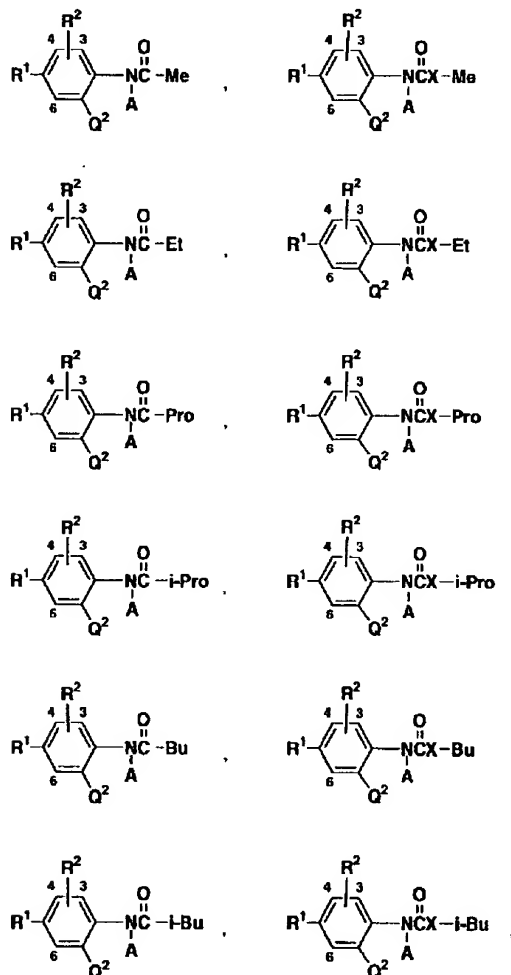
122

【0136】〔表4〕

【0137】

* 【化59】

*



【0138】

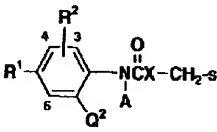
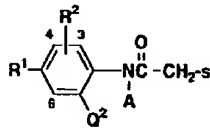
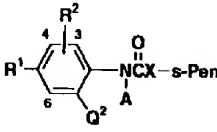
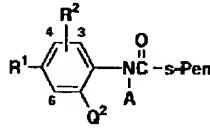
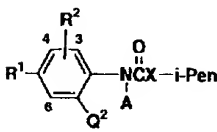
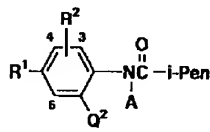
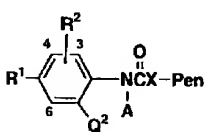
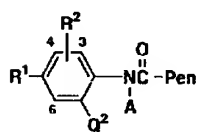
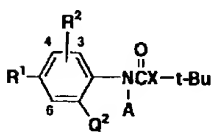
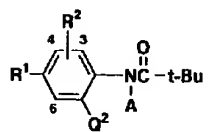
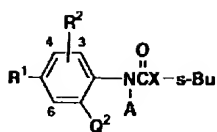
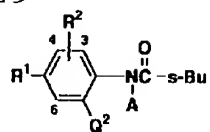
※ ※ 【化60】

(63)

特開平10-72434

123

124



【0139】

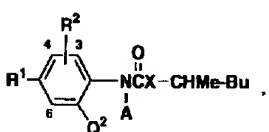
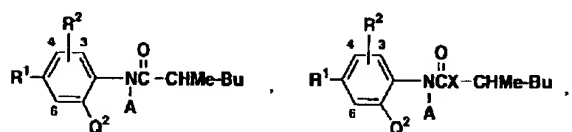
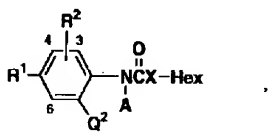
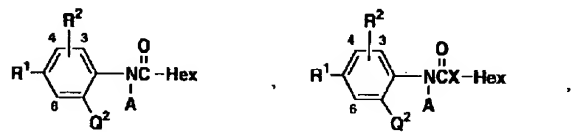
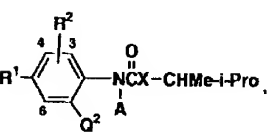
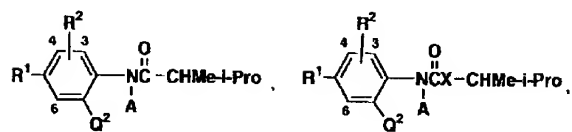
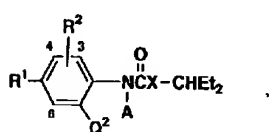
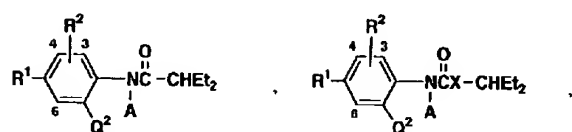
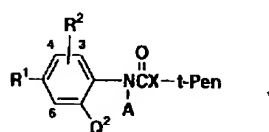
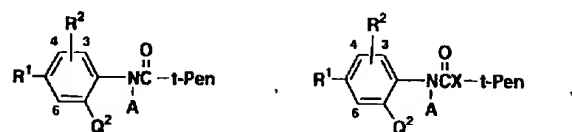
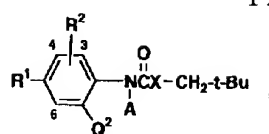
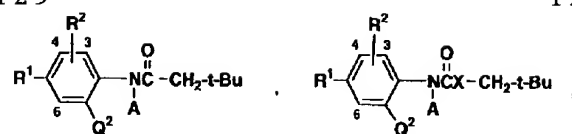
* * 【化61】

(64)

特開平10-72434

125

126



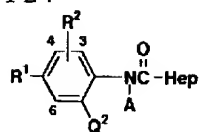
【0140】

* * 【化62】

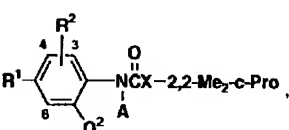
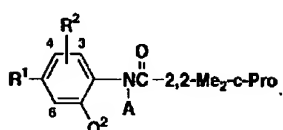
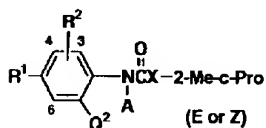
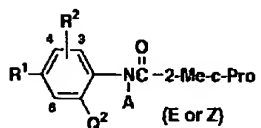
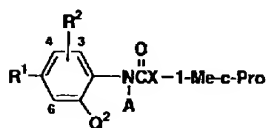
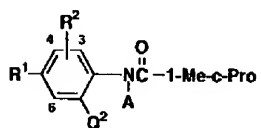
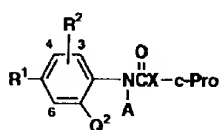
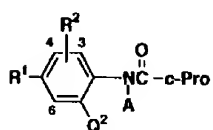
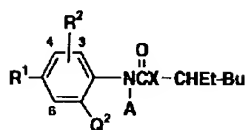
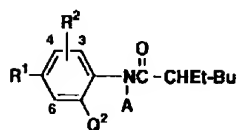
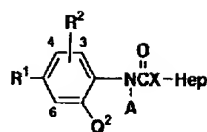
(65)

特開平10-72434

127



128



【0141】

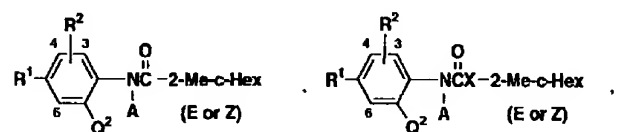
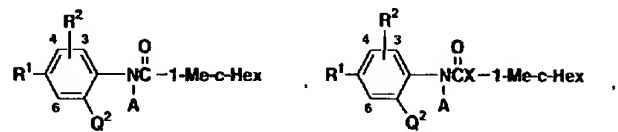
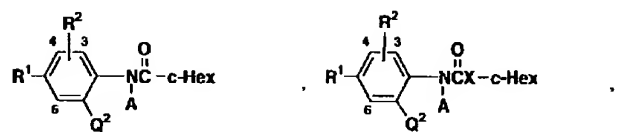
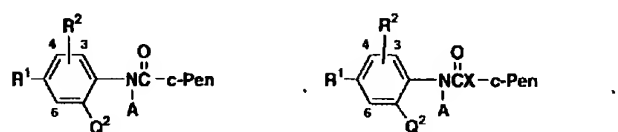
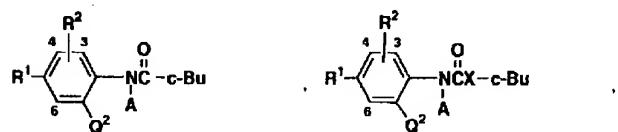
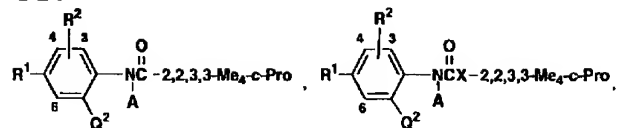
* * 【化63】

(66)

特開平10-72434

129

130



【0142】

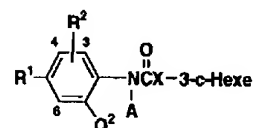
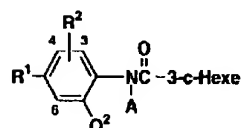
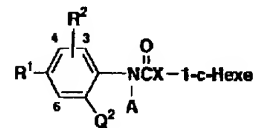
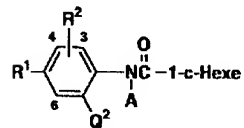
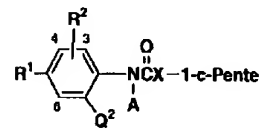
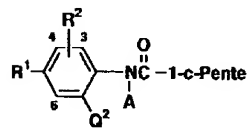
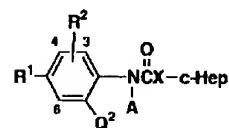
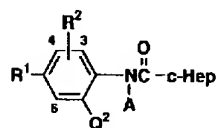
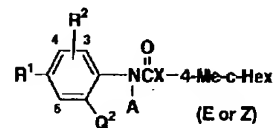
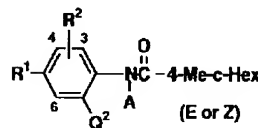
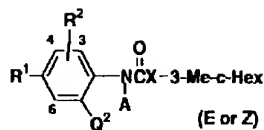
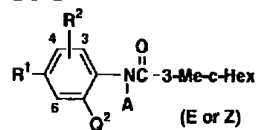
* * 【化64】

(67)

特開平10-72434

131

132



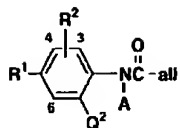
【0143】

* * 【化65】

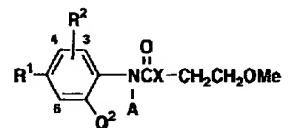
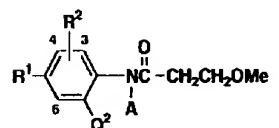
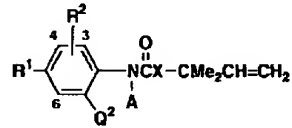
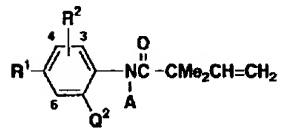
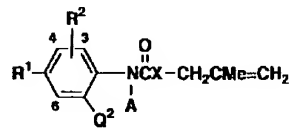
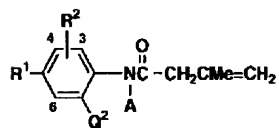
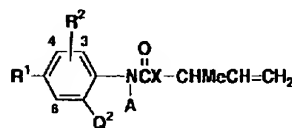
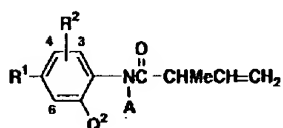
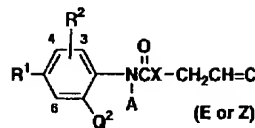
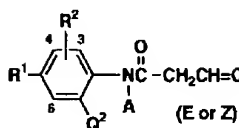
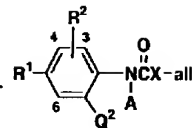
(68)

特開平10-72434

133



134



【0144】

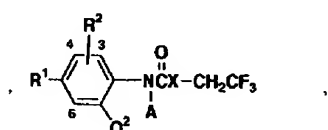
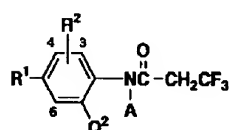
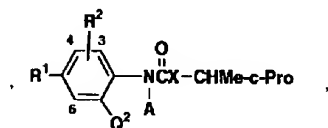
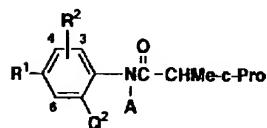
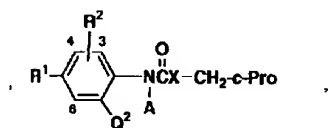
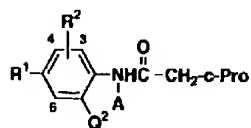
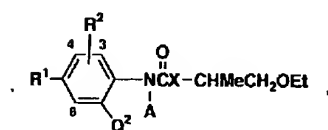
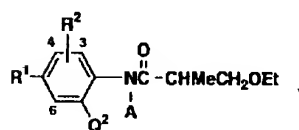
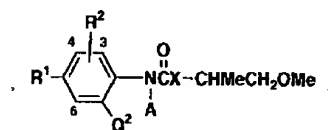
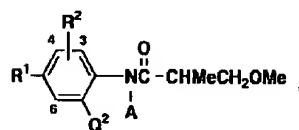
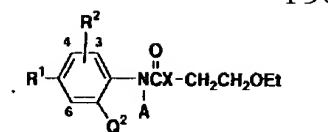
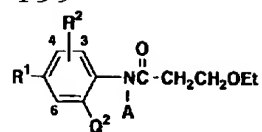
* * 【化66】

(69)

特開平10-72434

135

136



【0145】

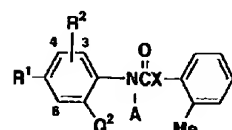
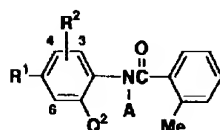
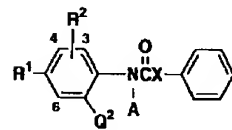
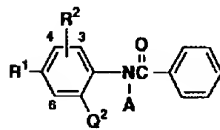
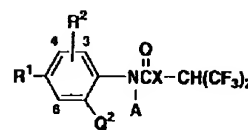
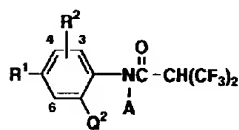
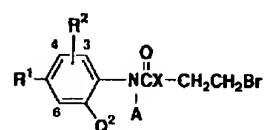
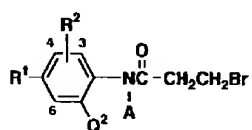
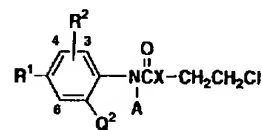
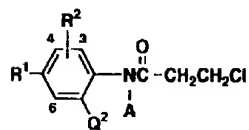
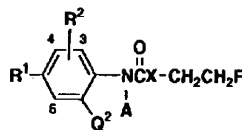
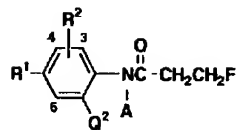
* * 【化67】

(70)

特開平10-72434

137

138



【0146】

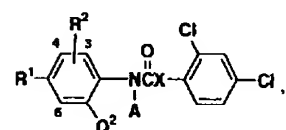
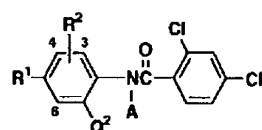
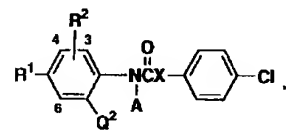
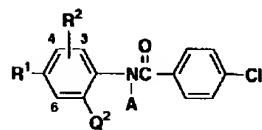
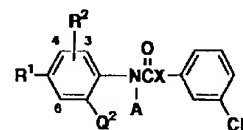
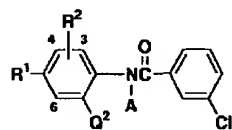
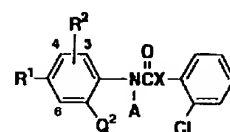
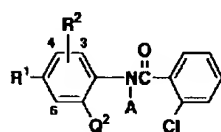
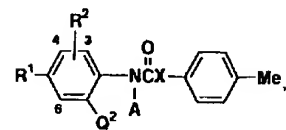
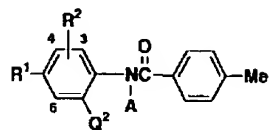
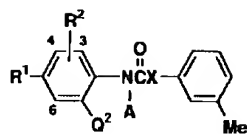
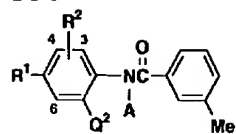
* * 【化68】

(71)

特開平10-72434

139

140



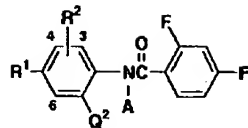
【0147】

* * 【化69】

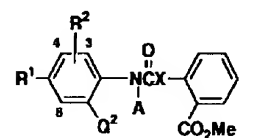
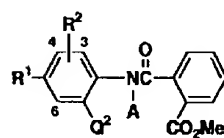
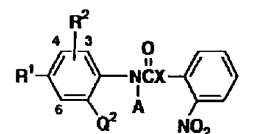
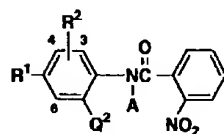
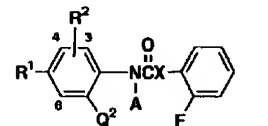
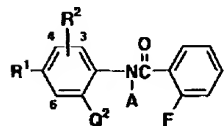
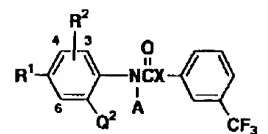
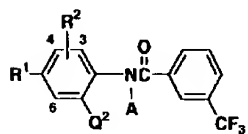
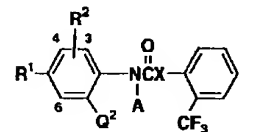
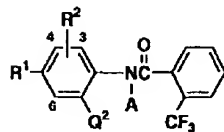
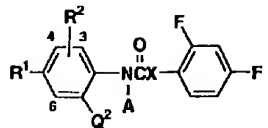
(72)

特開平10-72434

141



142



【0148】

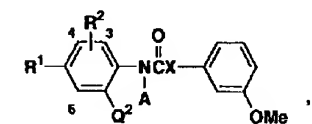
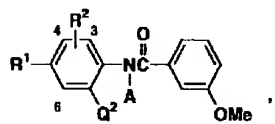
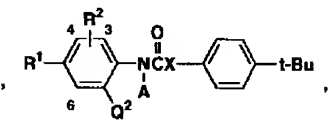
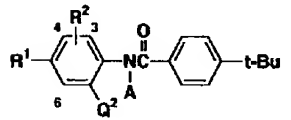
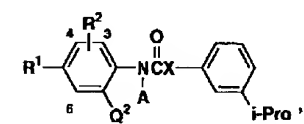
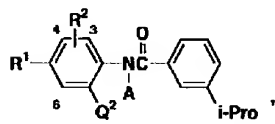
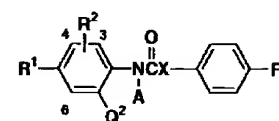
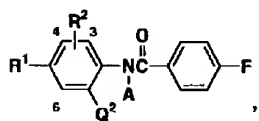
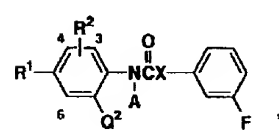
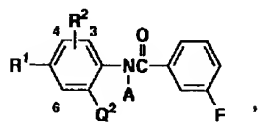
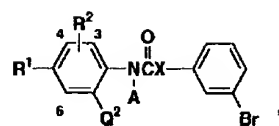
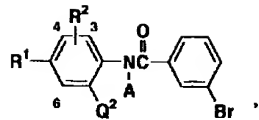
* * 【化70】

(73)

特開平10-72434

143

144



【0149】

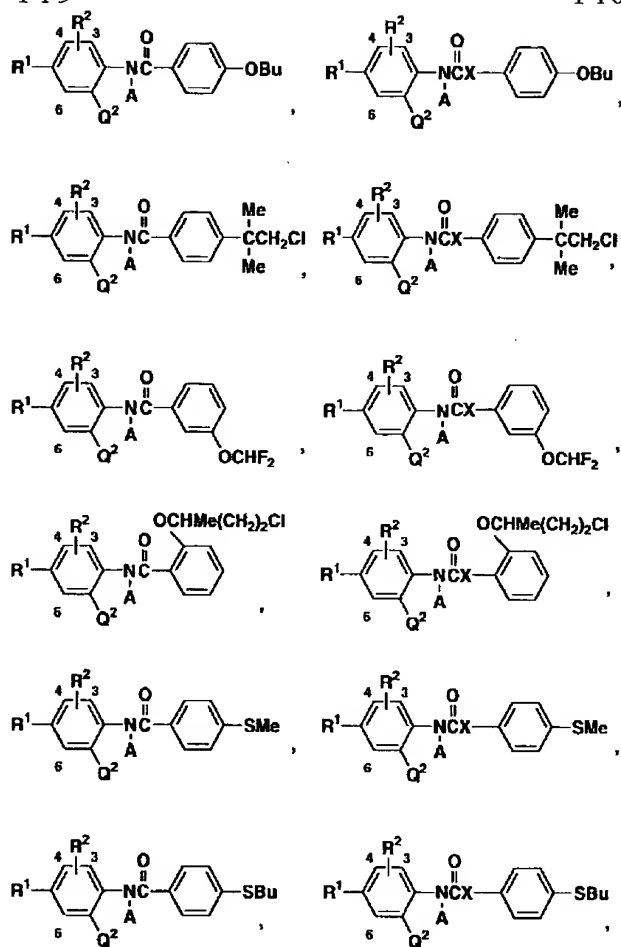
* 30 * 【化71】

(74)

特開平10-72434

145

146



【0150】

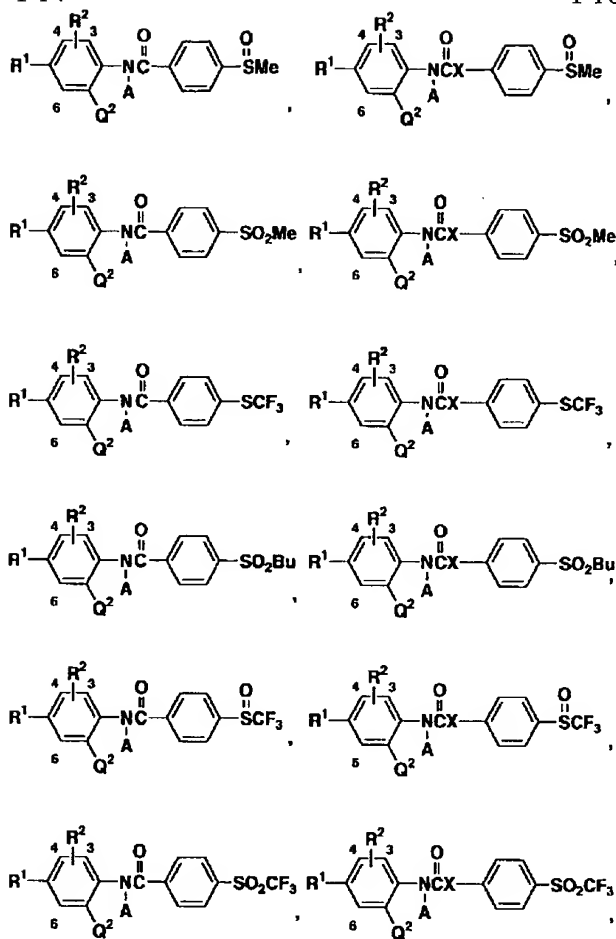
* 30 * 【化72】

(75)

特開平10-72434

147

148



【0151】

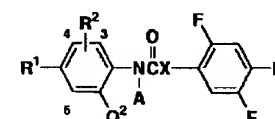
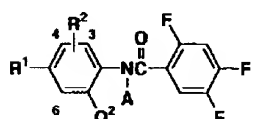
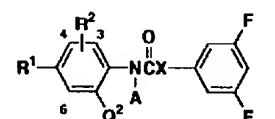
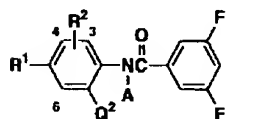
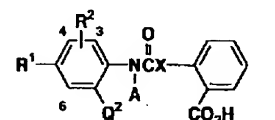
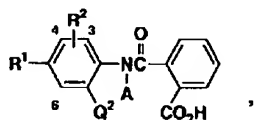
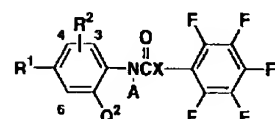
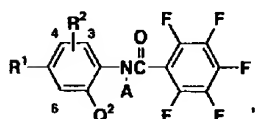
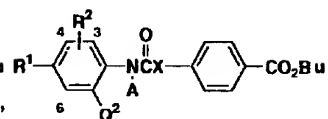
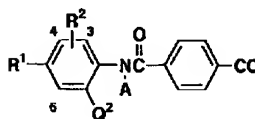
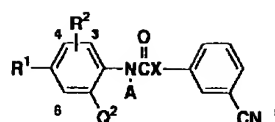
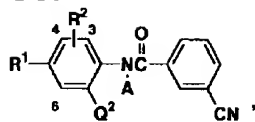
30【化73】

(76)

特開平10-72434

149

150



【0152】

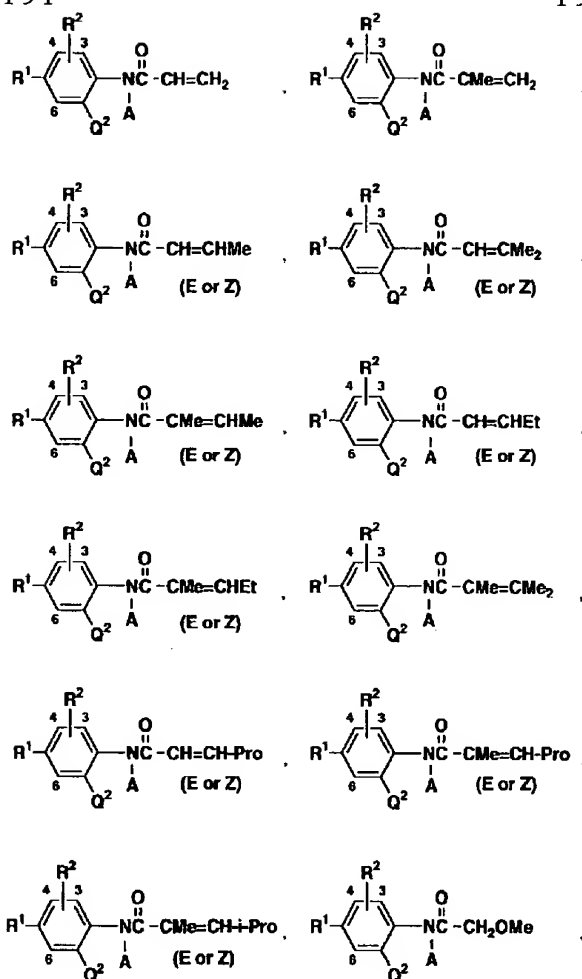
30【化74】

(77)

特開平10-72434

151

152



【0153】

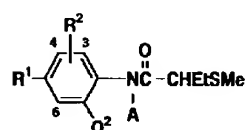
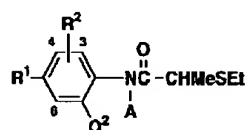
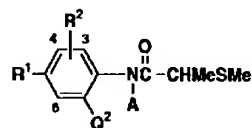
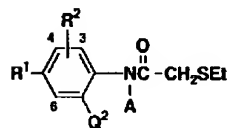
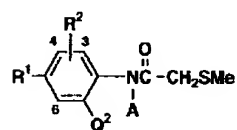
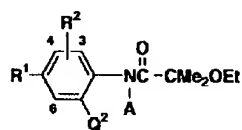
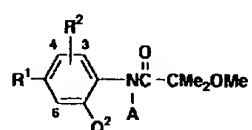
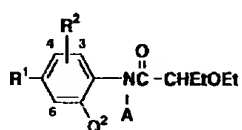
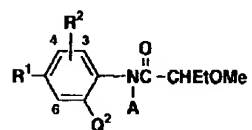
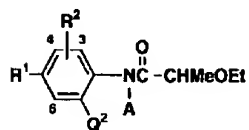
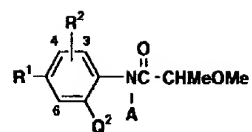
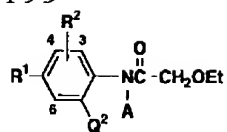
* * 【化75】

(78)

特開平10-72434

153

154



【0154】

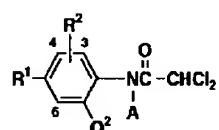
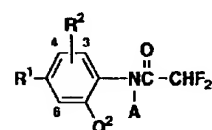
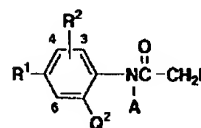
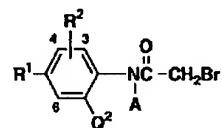
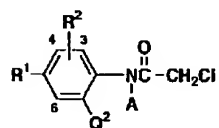
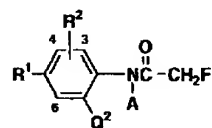
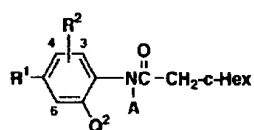
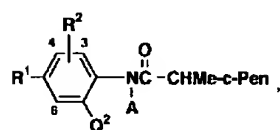
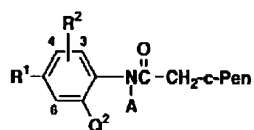
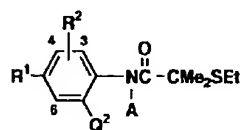
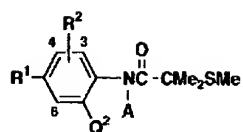
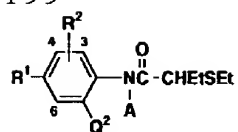
* * 【化76】

(79)

特開平10-72434

155

156



【0155】

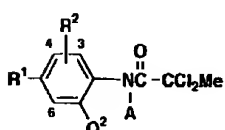
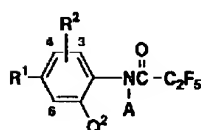
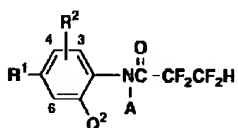
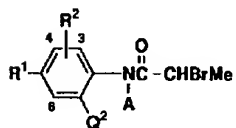
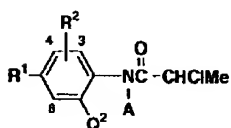
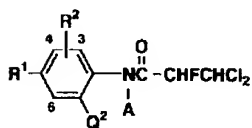
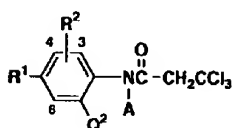
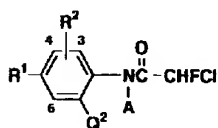
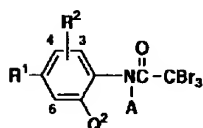
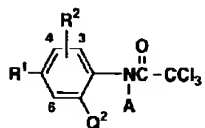
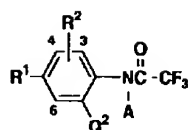
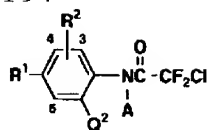
* * 【化77】

(80)

特開平10-72434

157

158



【0156】

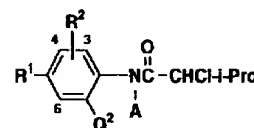
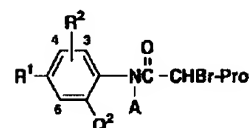
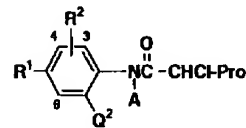
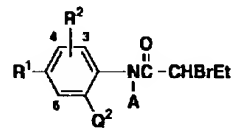
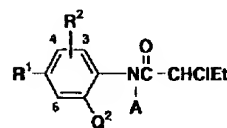
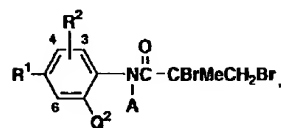
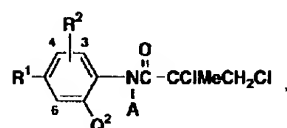
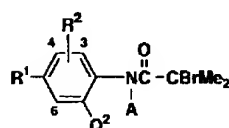
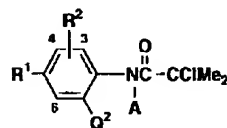
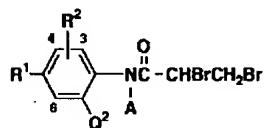
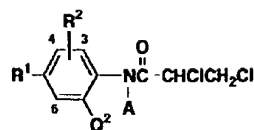
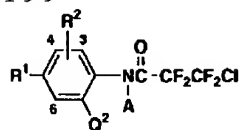
* * 【化78】

(81)

特開平10-72434

159

160



【0157】

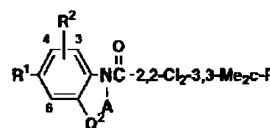
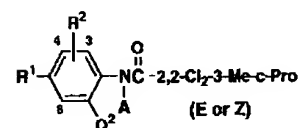
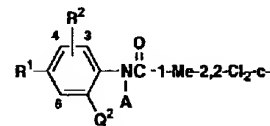
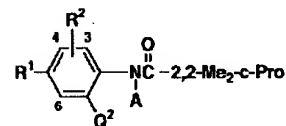
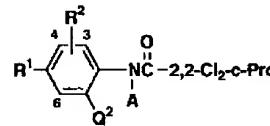
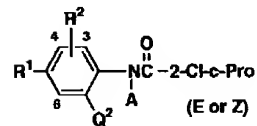
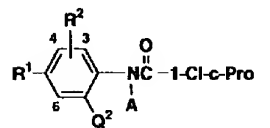
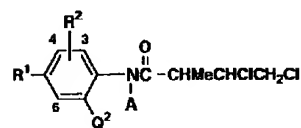
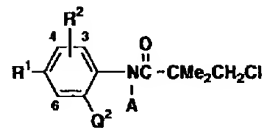
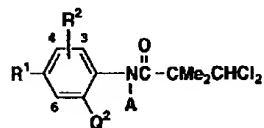
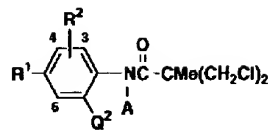
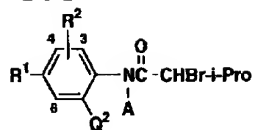
* * 【化79】

(82)

特開平10-72434

161

162



【0158】

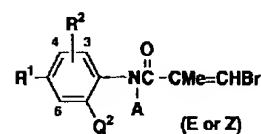
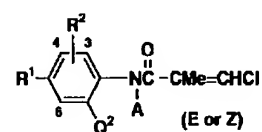
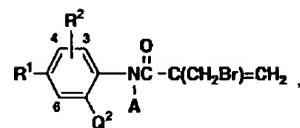
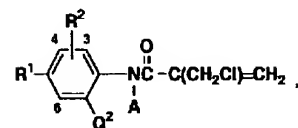
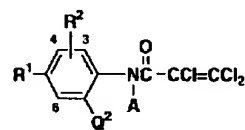
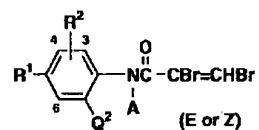
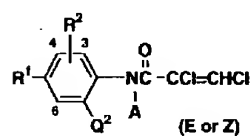
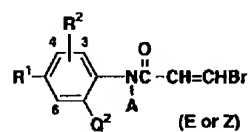
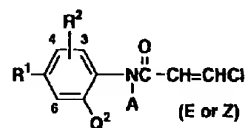
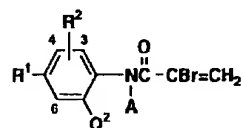
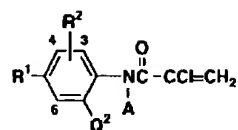
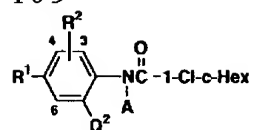
* * 【化80】

(83)

特開平10-72434

163

164



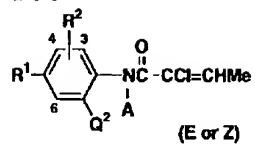
【0159】

* * 【化81】

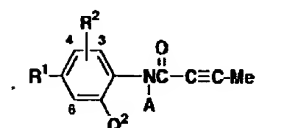
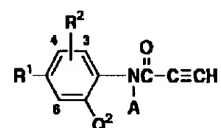
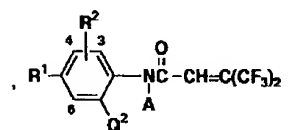
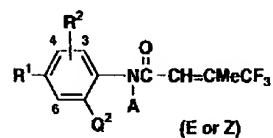
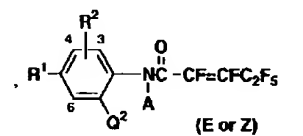
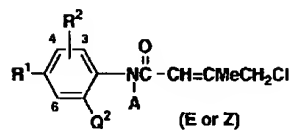
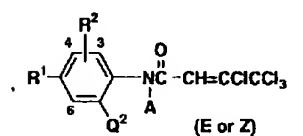
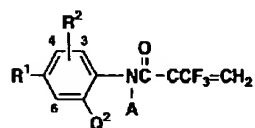
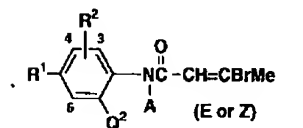
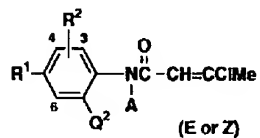
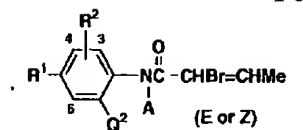
(84)

特開平10-72434

165



166



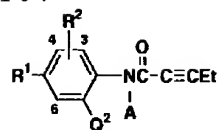
【0160】

* * 【化82】

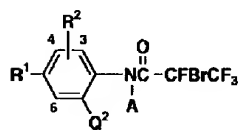
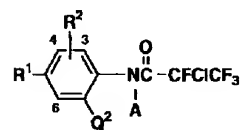
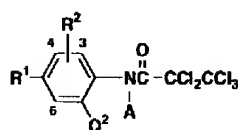
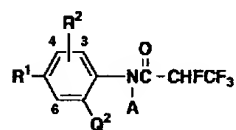
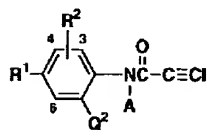
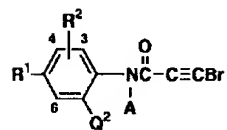
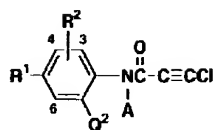
(85)

特開平10-72434

167



168



【0161】

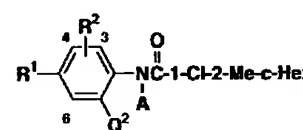
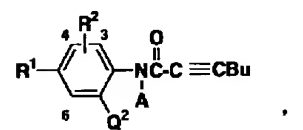
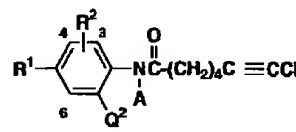
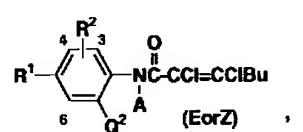
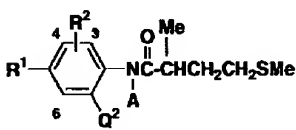
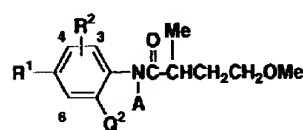
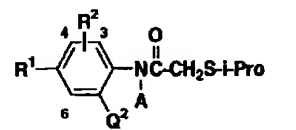
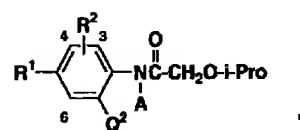
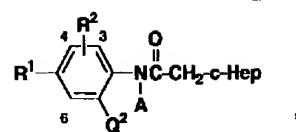
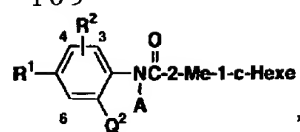
* * 【化83】

(86)

特開平10-72434

169

170

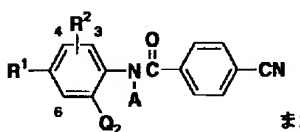
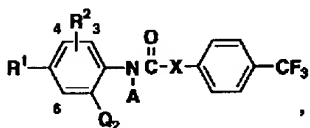
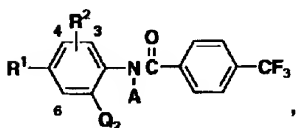
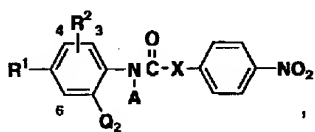
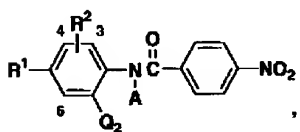
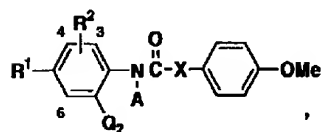
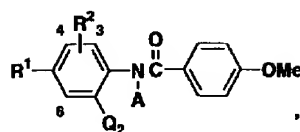
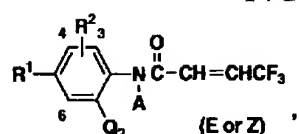
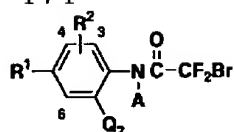


【0162】

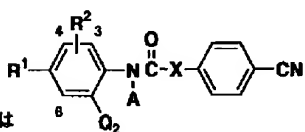
* * 【化84】

171

172



または



【0163】但し、AはH、CHO、MeCO、EtCO、ProCO、i-ProCO、BuCO、i-BuCO、s-BuCO、t-BuCO、CF₃CO、CF₂ClCO、CCl₃CO、CHCl₂CO、C₂F₅CO、CF₃CH₂CO、MeCHClCO、CHF₂CF₂CO、CF₂ClCF₂CO、EtCHClCO、i-ProCHBrCO、CO₂Me、CO₂Et、CO₂Pro、CO₂i-Pro、CO₂Bu、CO₂t-Bu、CO₂CH₂CF₃、CO₂CH(CF₃)₂、CO₂(CH₂)₄Cl、CH₂=CHCO、CH₂=CMeCO、MeCH=CHCO (E or Z)、Me₂C=CHCO、C(O)SMe、C(O)SEt、C(O)SBu、c-ProCO、1-Me-c-ProCO、2-Me-c-ProCO、c-Bu*

*CO、c-PenCO、c-HexCO、CO₂c-Pro、CO₂c-Pen、CO₂c-Hex、MeS、EtS、BuS、MeSO、EtSO、BuSO、MeSO₂、EtSO₂、ProSO₂、BuSO₂、CCl₃S、CF₃S、CF₂ClS、C₂F₅S、CF₃(CF₂)₃S、CCl₃SO、CF₃SO、CF₂ClSO、C₂F₅SO、CF₃(CF₂)₃SO、CCl₃SO₂、CF₃SO₂、CF₂ClSO₂、C₂F₅SO₂またはCF₃(CF₂)₃SO₂を示し、XはO、S、NH、MeN、EtN、ProNまたはiso-ProNを示す。

【0164】

【表33】

R ¹	R ²	Q ²
Me	H	3-Cl-Q-2
Me	H	3,5-Cl ₂ -Q-2
Me	H	3-Cl-5-Me-Q-2
Me	H	3,4-Cl ₂ -Q-2
Me	H	3,5-Cl ₂ -Q-2
Me	H	3,5-Cl ₂ -4-CO ₂ Me-Q-2

(88)

特開平10-72434

173

174

Me	H	3-Br-Q-2
Me	H	4-Cl-Q-2
Me	H	3-Me-4-Cl-Q-2
Me	H	3-i-Pro-5-Cl-Q-2
Me	H	3-t-Bu-5-Cl-Q-2
Me	H	3-CN-Q-2
Me	H	3-CN-5-Cl-Q-2
Me	H	3-CN-5-Me-Q-2
Me	H	3-CN-4-Cl-Q-2
Me	H	4-CN-Q-2
Me	H	3-Cl-4-NO ₂ -Q-2
Me	H	3-CCl ₃ -Q-2
Me	H	3-CCl ₃ -5-Cl-Q-2
Me	H	3-CCl ₃ -5-Me-Q-2
Me	H	3-CCl ₃ -5-Et-Q-2
Me	H	3-CF ₂ Cl-Q-2
Me	H	3-CF ₂ Cl-5-Cl-Q-2

【0165】

* * 【表34】

R ¹	R ²	Q ²
Me	H	3-CF ₂ Cl-5-Me-Q-2
Me	H	3-CF ₂ Cl-5-Et-Q-2
Me	H	3-CF ₂ Cl-5-F-Q-2
Me	H	3-CF ₃ -Q-2
Me	H	3-CF ₃ -5-Cl-Q-2
Me	H	3-CF ₃ -5-Me-Q-2
Me	H	3-CF ₃ -5-Et-Q-2
Me	H	3-CF ₃ -5-F-Q-2
Me	H	3-CF ₃ -4-Cl-Q-2
Me	H	3-CF ₃ -4-Cl-5-Me-Q-2
Me	H	3-CF ₃ -4-NO ₂ -Q-2
Me	H	3-CF ₃ -4-Me-Q-2
Me	H	3-CF ₃ -5-OMe-Q-2
Me	H	3-CF ₃ -4,5-Me ₂ -Q-2
Me	H	3-CF ₃ -4-CO ₂ Me-5-Cl-Q-2
Me	H	3-CF ₃ -5-Br-Q-2
Me	H	3-CF ₃ -4-Br-Q-2
Me	H	3,5-(CF ₃) ₂ -Q-2
Me	H	3-C ₂ F ₅ -Q-2
Me	H	3-C ₂ F ₅ -5-Cl-Q-2
Me	H	3-C ₂ F ₅ -5-Me-Q-2
Me	H	3-C ₂ F ₅ -5-Et-Q-2
Me	H	3-C ₂ F ₅ -5-F-Q-2

【0166】

※ ※ 【表35】

R ¹	R ²	Q ²
----------------	----------------	----------------

(89)

特開平10-72434

175

176

Me	H	3-C ₂ F ₅ -4-Cl-5-Me-Q-2
Me	H	3-C ₂ F ₅ -4-Cl-Q-2
Me	H	3-CF ₃ CH ₂ -Q-2
Me	H	3-CF ₃ CH ₂ -5-Cl-Q-2
Me	H	3-CF ₃ CH ₂ -5-Me-Q-2
Me	H	3-CF ₃ CH ₂ -5-Et-Q-2
Me	H	3-CF ₃ CH ₂ -4-Cl-5-Me-Q-2
Me	H	3-OCF ₃ -Q-2
Me	H	3-OCF ₃ -5-Cl-Q-2
Me	H	3-OCF ₃ -5-Me-Q-2
Me	H	3-OCF ₃ -5-Et-Q-2
Me	H	3-OCF ₃ -4-Cl-5-Me-Q-2
Me	H	3-OCHF ₂ -Q-2
Me	H	3-OCHF ₂ -5-Cl-Q-2
Me	H	3-OCHF ₂ -5-Me-Q-2
Me	H	3-OCHF ₂ -4-Cl-5-Me-Q-2
Me	H	3-C ₃ F ₇ -Q-2
Me	H	3-C ₃ F ₇ -5-Cl-Q-2
Me	H	3-C ₃ F ₇ -5-Me-Q-2
Me	H	3-Me-4-NO ₂ -Q-2
Me	H	3,5-Me ₂ -4-NO ₂ -Q-2
Me	H	3-i-Pro-4-NO ₂ -Q-2
Me	H	3-i-Pro-4-Cl-Q-2

【0167】

* * 【表36】

R ¹	R ²	Q ²
Me	H	3-t-Bu-4-NO ₂ -Q-2
Me	H	3-t-Bu-4-Cl-Q-2
Me	3-Cl	3-CF ₃ -Q-2
Me	3-Cl	3-CF ₃ -5-Me-Q-2
Me	3-Me	3-CF ₃ -Q-2
Me	3-Me	3-CF ₃ -5-Me-Q-2
Me	3-NO ₂	3-CF ₃ -Q-2
Me	3-NO ₂	3-CF ₃ -5-Me-Q-2
Me	3-OMe	3-CF ₃ -Q-2
Me	3-OMe	3-CF ₃ -5-Me-Q-2
Me	4-NO ₂	3-CF ₃ -Q-2
Me	4-NO ₂	3-CF ₃ -5-Me-Q-2
Cl	H	3-CF ₃ -Q-2
Cl	H	3-CF ₃ -5-Cl-Q-2
Cl	H	3-CF ₃ -5-Me-Q-2
Et	H	3-CF ₃ -Q-2
Et	H	3-CF ₃ -5-Cl-Q-2
Et	H	3-CF ₃ -5-Me-Q-2
OMe	H	3-CF ₃ -Q-2
OMe	H	3-CF ₃ -5-Cl-Q-2
OMe	H	3-CF ₃ -5-Me-Q-2
SMe	H	3-CF ₃ -Q-2



		(90)	特開平10-72434
177			178
SMe	H	3-CF ₃ -5-Cl-Q-2	
【0168】		* * 【表37】	
R ¹	R ²	Q ²	
SMe	H	3-CF ₃ -5-Me-Q-2	
Me	H	5-CF ₃ -Q-3(R ⁴ :H)	
Me	H	5-CF ₃ -Q-3(R ⁴ :Me)	
Me	H	5-CF ₃ -4-Cl-Q-3(R ⁴ :Me)	
Me	H	5-CF ₃ -4-Me-Q-3(R ⁴ :Me)	
Cl	H	5-CF ₃ -Q-3(R ⁴ :Me)	
Me	H	3-CF ₃ -5-Me-Q-4(R ⁴ :Me)	
Me	H	3-CF ₃ -5-Me-Q-4(R ⁴ :H)	
Me	H	3-Me-5-CF ₃ -Q-4(R ⁴ :Me)	
Me	H	3-CF ₃ -Q-5(R ⁴ :H)	
Me	H	3-CF ₃ -Q-5(R ⁴ :Me)	
Cl	H	3-CF ₃ -Q-5(R ⁴ :Me)	
Me	H	5-CF ₃ -Q-15	
Me	H	5-CF ₃ -4-Me-Q-15	
Cl	H	5-CF ₃ -Q-15	
Me	H	3-CF ₃ -5-Me-Q-16	
Me	H	3-Me-5-CF ₃ -Q-16	
Me	H	3-CF ₃ -Q-17	
Me	H	3-CF ₃ -4-Me-Q-17	
Cl	H	3-CF ₃ -Q-17	

【0169】但し、表3及び表4中のQ-1～Q-32 ※【0170】
は下記を表す。 ※ 【化85】

(91)

特開平10-72434

179



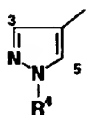
Q-1



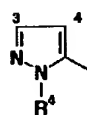
Q-2



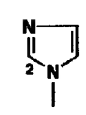
Q-3



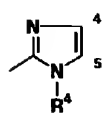
Q-4



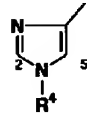
Q-5



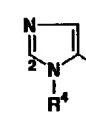
Q-6



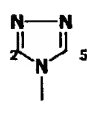
Q-7



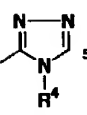
Q-8



Q-9



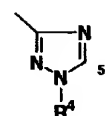
Q-10



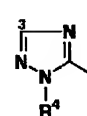
Q-11



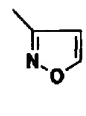
Q-12



Q-13



Q-14



Q-15

180

【0171】

* * 【化86】

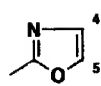
181



Q-16



Q-17



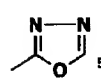
Q-18



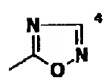
Q-19



Q-20



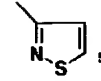
Q-21



Q-22



Q-23



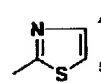
Q-24



Q-25



Q-26



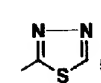
Q-27



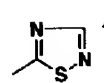
Q-28



Q-29



Q-30



Q-31



Q-32

【0172】本発明化合物を除草剤として施用するにあたっては、一般には適当な担体、例えばクレー、タルク、ペントナイト、珪藻土、ホワイトカーボン等の固体担体あるいは水、アルコール類（イソプロパノール、ブタノール、ベンジルアルコール、フリフリルアルコール等）、芳香族炭化水素類（トルエン、キシレン等）、エーテル類（アニソール類）、ケトン類（シクロヘキサノン、イソホロン類）、エステル類（酢酸ブチル類）、酸アミド類（N-メチルピロリドン等）またはハロゲン化炭化水素類（クロルベンゼン等）などの液体担体と混用して適用することができ、所望により界面活性剤、乳化剤、分散剤、浸透剤、展着剤、増粘剤、凍結防止剤、固40 結防止剤、安定剤などを添加し、液剤、乳剤、水和剤、ドライフロアブル剤、フロアブル剤、粉剤、粒剤等任意の剤型にて実用に供することができる。

【0173】また、本発明化合物は必要に応じて製剤または散布時に他種の除草剤、各種殺虫剤、殺菌剤、植物生長調節剤、共力剤などと混合施用しても良い。特に、他の雑草剤と混合施用することにより、施用薬量の減少による低コスト化、混合薬剤の相乗作用による殺草スペクトラムの拡大や、より高い殺草効果が期待できる。この際、同時に複数の公知除草剤との組み合わせも可能で*50

*ある。本発明化合物と混合使用する除草剤の種類としては、例えば、ファーム・ケミカルズ・ハンドブック (Farm Chemicals Handbook)、1995年版に記載されている化合物などがある。

【0174】本発明化合物の除草剤としての施用薬量は適用場面、施用時期、施用方法、栽培作物等により差異はあるが一般には有効成分量としてヘクタール(ha)当たり0.0001~10kg程度、好ましくは0.001~5kg程度が適当である。次に具体的に本発明化合物を用いる場合の製剤の配合例を示す。但し本発明の配合例は、これらのみに限定されるものではない。なお、以下の配合例において「部」は重量部を意味する。

【0175】〔水和剤〕

発明化合物	5~80部
固体担体	10~85部
界面活性剤	1~10部
その他	1~5部

その他として、例えば固結防止剤などがあげられる。

【0176】〔乳剤〕

本発明化合物	1~30部
液体担体	55~95部
界面活性剤	4~15部

〔フロアブル剤〕

本発明化合物	5~70部
液体担体	15~65部
界面活性剤	5~12部
その他	5~30部
その他として、例えば凍結防止剤、増粘剤等があげられる。	

【0177】〔粒状水和剤（ドライフロアブル剤）〕

本発明化合物	20~90部
固体担体	9~60部
界面活性剤	1~20部
〔粒剤〕	
本発明化合物	0.01~10部
固体担体	90~99.99部
その他	0~5部

〔配合例1〕水和剤

本発明化合物 No. C-55	50部
ジークライト PF	43部
（カオリン系クレー：ジークライト工業（株）商品名）	
ソルボール 5050	2部
（アニオン性界面活性剤：東邦化学工業（株）商品名）	
ルノックス 1000C	3部
（アニオン性界面活性剤：東邦化学工業（株）商品名）	
カープレックス #80（固結防止剤）	2部
（ホワイトカーボン：塩野義製薬（株）商品名）	
以上を均一に混合粉砕して水和剤とする。	

【0178】〔配合例2〕乳剤

本発明化合物 No. C-46	3部
キシレン	76部
イソホロン	15部
ホルボール 3005X	6部
（非イオン性界面活性剤とアニオン性界面活性剤との混合物：東邦化学工業（株）商品名）	
以上を均一に混合して乳剤とする。	

【0179】〔配合例3〕フロアブル剤

本発明化合物 No. C-4	35部
アグリゾール S-711	8部
（非イオン性界面活性剤：花王（株）商品名）	
ルノックス 1000C	0.5部
（アニオン性界面活性剤：東邦化学工業（株）商品名）	
1%ロドボール水	20部
（増粘剤：ローン・ブーラン社商品名）	
エチレングリコール（凍結防止剤）	8部
水	28.5部
以上を均一に混合して、フロアブル剤とする。	

【0180】

〔配合例4〕粒状水和剤（ドライフロアブル剤）

本発明化合物 No. C-31	75部
イソパン No.1	10部
（アニオン性界面活性剤：クラレイソブレンケミカル	

（株）商品名）

バニレックス N	5部
（アニオン性界面活性剤：山陽国策パルプ（株）商品名）	
カープレックス #80	10部
（ホワイトカーボン：塩野義製薬（株）商品名）	
以上を均一に混合微粉砕してドライフロアブル剤とする。	

【0181】〔配合例5〕粒剤

10 本発明化合物 No. C-20	0.1部
ベントナイト	55.0部
タルク	44.9部

以上を均一に混合粉砕した後、少量の水を加えて攪拌混合捏和し、押出式造粒機で造粒し、乾燥して粉剤にする。

【0182】使用に際しては上記水和剤、乳剤、フロアブル剤、粒状水和剤は水で50~1000倍に希釈して、有効成分が1~10,000ppm、もしくは有効成分が1ヘクタール(ha)当たり0.0001~10kgになるように散布する。次に、

20 本発明化合物の除草剤としての有用性を以下の試験例において具体的に説明する。

【0183】〔試験例1〕土壌処理による除草剤効果試験

縦21cm、横13cm、深さ7cmのプラスチック製箱に殺菌した洪積土壌を入れ、ノビエ(A)、エノコログサ(B)、イチビ(C)、アオビユ(D)、アサガオ(E)、トウモロコシ(a)、ダイズ(b)およびワタ(c)の種子をそれぞれスポット状に播種し、約1.5cm覆土した後、本発明化合物の有効成分量が所定の割合になるように土壌表面へ小型スプレーで均一に散布した。散布の際の薬液は、前記配合例等に準じて適宜調整された水和剤を水で希釈して用いた。薬液散布3週間後に作物および雑草に対する除草効果を下記の判定基準に従い調査した。抑制の程度は肉眼による観察調査から求めた。結果を表5に示す。

【0184】5: 完全枯死あるいは90%以上の抑制

4: 70%~90%の抑制

3: 40%~70%の抑制

2: 20%~40%の抑制

1: 5%~20%の抑制

0: 5%未満の抑制

【0185】〔試験例2〕茎葉処理による除草効果試験

縦21cm、横13cm、深さ7cmのプラスチック製箱に殺菌した洪積土壌を入れ、ノビエ(A)、エノコログサ(B)、イチビ(C)、アオビユ(D)、アサガオ(E)およびオナモミ(F)の種子をそれぞれスポット状に播種し、約1.5cm覆土した。各植物が2~3葉期に達したとき、本発明化合物の有効成分量が所定の割合になるように茎葉部へ小型スプレーで均一に散布した。散布の際の薬液は、前記配合例等に準じて適宜調整された水和剤を水で希釈して用いた。薬液散布3週間後に雑草に対する除草効果を試験例1の

185

判定基準に従い調査した。結果を表6に示す。

【0186】〔試験例3〕湛水条件による除草効果試験
1/10000アールのワグネルポット中に沖積土壌を入れた後、水を入れて混和し、水深4cmの湛水条件にした。ノビエ(A)、ホタルイ(G)、コナギ(H)およびキカシグサ(I)の種子を上記のポットに播種した後、2.5葉期のイネ苗(d)を移植した。播種1日後に、本発明化合物の有効成分量が所定の割合になるように、水面ヘメスピベットで滴下処理した。滴下の際の薬液は、前記配合例等に準じて適宜調整した水和剤を希釈して用いた。ポットを25〜30℃の温室内に置いて植物を育成し、薬液滴下後3週間目にイネおよび雑草に対する除草効果を試験例1の判定基準に従い調査した。結果を表7に示す。

【0187】

【表38】〔表5〕

No.	薬量 kg/ha	A	B	C	D	E	a	b	c
C-1	0.63	5	5	5	5	5	5	0	0
C-2	2.5	5	5	0	2	4	2	0	0
C-3	2.5	5	5	0	0	1	0	0	0
C-4	0.63	5	5	5	5	5	4	0	0
C-5	2.5	5	5	5	5	5	2	0	0
C-8	0.63	5	5	4	5	5	2	0	4
C-9	2.5	5	5	0	5	4	0	0	0
C-10	2.5	5	5	5	5	5	2	0	0
C-12	2.5	5	5	5	5	4	0	0	0
C-16	0.63	5	5	5	5	2	0	0	0
C-17	0.63	5	5	5	4	4	0	0	0
C-20	2.5	5	5	5	5	5	2	0	0
C-31	0.63	5	5	5	5	5	1	2	0
C-32	0.63	5	5	5	5	5	0	0	0
C-39	0.63	5	5	5	5	5	0	0	0
C-44	0.63	5	5	4	4	4	0	0	0
C-46	0.63	5	5	2	5	4	0	0	0
C-54	0.63	5	5	5	5	0	2	0	0
C-55	0.63	5	5	5	5	1	1	0	0
C-57	2.5	5	5	5	5	5	3	1	0
C-58	0.63	5	5	0	5	4	0	0	0
C-59	2.5	5	5	5	5	5	3	0	0

【0188】

【表39】

No.	薬量 kg/ha	A	B	C	D	E	a	b	c
C-60	0.63	5	5	0	5	5	2	0	0
C-62	2.5	5	5	2	5	5	1	0	0
C-68	0.63	5	5	5	5	5	1	0	2
C-72	0.63	5	5	5	5	2	2	0	1

186

C-77	0.63	5	5	5	5	3	0	0	0
C-79	2.5	5	5	5	5	5	0	0	0
C-80	2.5	5	5	5	5	5	2	0	0
C-84	0.63	5	5	5	5	2	0	3	2
C-85	0.63	5	5	5	5	3	0	3	0
C-86	0.63	5	5	5	5	4	3	1	5
C-87	0.63	5	5	5	5	5	1	3	5
C-88	2.5	5	5	5	5	3	3	0	3
C-89	0.63	5	5	5	5	5	3	0	4
C-90	0.63	5	5	5	5	5	1	0	0
C-91	0.63	5	5	5	5	5	3	3	4
C-92	0.63	5	5	5	5	5	2	3	0
C-93	0.63	5	5	5	5	5	3	0	0
C-94	0.63	5	5	5	5	2	0	0	0
C-97	0.63	5	5	5	5	5	3	3	0
C-98	0.63	5	5	0	5	2	3	0	0
C-99	0.63	5	5	5	0	0	3	0	0
C-100	2.5	5	5	5	5	4	3	0	0
C-101	2.5	5	5	5	5	5	2	0	0

【0189】

【表40】

No.	薬量 kg/ha	A	B	C	D	E	a	b	c
C-103	2.5	5	5	0	0	0	2	0	0
C-104	2.5	5	5	5	5	5	0	0	0
C-105	0.63	5	5	5	5	5	2	0	0
C-106	0.63	5	4	5	5	5	2	0	0
C-108	2.5	5	5	1	1	1	0	0	0
C-110	2.5	5	5	5	5	1	0	0	0
C-111	2.5	5	5	5	5	5	3	4	0
C-113	2.5	5	5	5	5	4	0	0	0
C-118	2.5	5	5	5	5	5	3	3	4
C-119	0.63	5	5	5	5	4	0	0	0
C-120	0.63	5	5	5	5	5	2	0	0
C-122	2.5	5	5	5	0	5	1	0	0
C-123	2.5	5	5	2	5	1	3	0	0
C-124	0.63	5	5	5	5	5	3	0	0
C-125	0.63	5	5	4	5	4	2	0	0
C-126	2.5	5	5	5	5	5	1	0	0
C-135	2.5	4	5	5	5	0	2	0	0
C-137	0.63	5	5	5	5	5	3	0	0
C-140	0.63	5	5	5	5	5	0	0	0
C-141	0.63	5	5	5	5	5	3	0	0
C-143	0.63	5	5	5	5	5	2	0	0
C-144	0.63	5	5	5	5	5	3	2	0
C-145	0.63	5	5	5	5	1	0	0	0

50 【0190】

187

【表41】

No.	薬量 kg/ha	A	B	C	D	E	a	b	c
C-146	2.5	5	5	5	5	5	2	0	5
C-147	0.63	5	5	5	5	5	3	3	2
C-148	2.5	5	5	5	5	5	3	3	4
C-150	2.5	5	5	5	5	5	1	0	1
C-151	2.5	5	5	5	5	5	3	0	1
C-152	2.5	5	5	5	5	4	3	2	0
C-153	0.63	5	5	5	5	5	2	2	2
C-154	2.5	5	5	5	5	5	3	3	0
C-155	2.5	5	5	5	5	5	3	3	3
C-157	2.5	5	5	5	5	5	0	0	0
C-158	0.63	5	5	5	5	5	3	0	2
C-159	0.63	5	5	5	5	5	3	2	0
C-160	2.5	5	5	5	5	5	3	2	0
C-161	2.5	5	5	5	5	2	2	0	0
C-163	2.5	5	5	5	5	5	3	0	0
C-165	0.63	5	5	5	5	5	3	3	0
C-166	2.5	5	5	5	5	5	2	0	0
C-168	0.63	5	5	5	5	5	0	0	2
D-1	0.63	5	5	5	5	5	3	4	5
D-2	0.63	5	5	5	2	4	0	2	0
D-3	0.63	5	5	5	5	4	2	3	0
D-4	0.63	5	5	5	5	5	3	4	2
D-5	0.63	5	5	5	5	5	3	3	3

【0191】

【表42】

No.	薬量 kg/ha	A	B	C	D	E	a	b	c
D-6	2.5	5	5	5	5	5	3	3	3
D-7	2.5	5	5	5	5	5	3	3	0
D-8	0.63	5	5	5	5	5	3	0	0
D-9	2.5	5	5	5	5	5	2	0	0
D-10	2.5	5	5	5	5	5	0	0	0
D-11	0.63	5	5	5	5	5	3	0	1
D-12	0.63	5	5	5	5	5	3	4	4
D-13	2.5	5	5	5	5	5	0	0	0
D-14	0.63	5	5	5	5	5	4	3	0
D-15	2.5	5	5	5	5	5	3	3	0
D-16	0.63	5	5	5	5	5	3	5	3
D-17	0.63	5	5	5	5	5	3	0	0
D-18	0.63	5	5	5	5	5	3	4	0
D-19	0.63	5	5	5	5	5	4	4	3
D-20	0.63	5	5	5	5	5	3	3	0
D-21	0.63	5	5	5	5	5	3	3	0

188

【0192】

【表43】〔表6〕

No.	薬量 kg/ha	A	B	C	D	E	F
C-4	2.5	5	5	5	3	5	4
C-5	2.5	5	5	5	4	5	2
C-8	2.5	5	4	5	5	4	5
C-10	2.5	5	5	5	2	5	4
10 C-31	0.63	5	5	4	2	5	4
C-32	0.63	5	5	4	3	5	3
C-54	2.5	5	5	5	5	5	5
C-55	2.5	5	5	4	2	5	1
C-57	2.5	5	5	4	4	5	4
C-58	2.5	5	5	5	4	4	0
C-59	2.5	5	5	5	5	5	4
C-60	2.5	5	5	2	5	5	4
C-61	2.5	5	5	5	5	5	5
C-68	0.63	5	5	5	5	5	5
20 C-72	0.63	5	5	4	2	4	0
C-77	2.5	5	5	4	4	4	2
C-80	2.5	5	5	4	2	4	2
C-84	2.5	5	5	5	5	5	5
C-85	2.5	5	5	5	5	5	4
C-86	2.5	5	5	5	5	5	2
C-87	2.5	5	5	5	5	5	5
C-88	2.5	5	5	5	4	4	0

【0193】

30 【表44】

No.	薬量 kg/ha	A	B	C	D	E	F
C-89	2.5	5	5	5	4	5	4
C-90	2.5	5	5	4	4	5	4
C-91	2.5	5	5	4	4	5	4
C-92	2.5	5	5	5	2	5	3
C-93	0.63	5	5	4	4	4	4
C-97	2.5	4	4	4	4	5	4
40 C-98	2.5	5	5	4	5	-	-
C-105	2.5	5	5	4	2	5	0
C-119	2.5	5	5	4	4	5	4
C-120	0.63	5	5	5	4	4	2
C-122	2.5	5	5	5	3	5	0
C-124	2.5	5	5	5	5	5	1
C-125	2.5	5	5	4	4	4	1
C-137	2.5	4	5	5	5	5	5
C-141	2.5	5	5	5	5	5	0
C-143	2.5	5	5	4	2	4	4
50 C-147	2.5	5	5	5	4	5	4

(96)

特開平10-72434

189

C-158	2.5	5	5	5	5	4	4
C-159	2.5	5	5	5	4	5	4
D-1	2.5	5	5	4	4	5	5
D-8	2.5	5	5	5	3	3	4
D-11	2.5	5	5	5	3	5	5
D-12	2.5	5	5	5	4	5	5

【0194】

【表45】

No.	薬量 kg/ha	A	B	C	D	E	F
D-14	2.5	5	5	4	4	5	5
D-15	2.5	5	5	5	4	5	5
D-16	2.5	5	5	4	4	4	4
D-19	0.63	5	5	4	4	4	4
D-21	2.5	5	5	4	4	4	4

【0195】

【表46】〔表7〕

No.	薬量 kg/ha	A	G	H	I	d
C-1	0.25	5	5	5	5	0
C-2	1.0	5	5	5	5	0
C-3	1.0	5	4	5	5	0
C-4	0.25	5	5	5	5	0
C-5	1.0	5	5	5	5	0
C-6	1.0	5	5	5	5	0
C-7	1.0	5	5	5	5	0
C-8	0.25	5	5	5	5	0
C-9	1.0	5	5	5	5	0
C-10	0.25	5	5	5	5	0
C-12	1.0	5	5	5	5	0
C-16	0.25	5	5	5	5	0
C-20	1.0	5	5	5	5	0
C-26	0.25	5	5	5	5	0
C-31	0.25	5	5	5	5	1
C-32	0.25	5	5	5	5	0
C-39	0.25	5	5	5	5	0
C-41	0.25	5	5	5	5	0
C-42	0.25	5	5	5	5	0
C-44	0.25	5	5	5	5	0
C-45	0.25	5	5	5	5	0
C-46	0.25	5	5	5	5	1

【0196】

【表47】

No.	薬量 kg/ha	A	G	H	I	d
-----	----------	---	---	---	---	---

190

C-47	1.0	5	5	5	5	0
C-49	1.0	5	2	5	5	0
C-50	1.0	5	4	5	5	0
C-54	1.0	5	5	5	5	0
C-55	1.0	5	5	5	5	0
C-56	1.0	5	5	5	5	0
C-57	1.0	5	5	5	5	2
C-58	1.0	5	5	5	5	0
10 C-59	1.0	5	5	5	5	0
C-60	1.0	5	5	5	5	0
C-61	1.0	5	5	5	5	0
C-62	1.0	5	5	5	5	0
C-67	0.25	5	5	5	5	0
C-68	0.25	5	5	5	5	0
C-69	0.25	5	5	5	5	0
C-72	0.25	5	5	5	5	0
C-73	0.25	5	5	5	5	0
C-74	0.25	5	4	5	5	0
20 C-77	1.0	5	5	5	5	0
C-79	1.0	5	5	5	5	0
C-80	1.0	5	5	5	5	0
C-84	1.0	5	5	5	5	0
C-85	1.0	5	5	5	5	0

【0197】

【表48】

No.	薬量 kg/ha	A	G	H	I	d
30 C-86	1.0	5	5	5	5	0
C-87	0.25	5	5	5	5	0
C-88	0.25	5	5	5	5	0
C-89	0.25	5	5	5	5	0
C-90	0.25	5	5	5	5	0
C-91	0.25	5	5	5	5	0
C-92	0.25	5	5	5	5	0
C-93	0.25	5	5	5	5	0
C-94	0.25	5	5	5	5	0
40 C-96	0.25	5	5	5	5	0
C-97	0.25	5	5	5	5	0
C-98	0.25	5	5	5	5	0
C-99	0.25	5	5	5	5	0
C-100	0.25	5	5	5	5	0
C-101	0.25	5	5	5	5	0
C-102	0.25	5	5	5	5	0
C-103	0.25	5	5	5	5	0
C-104	0.25	5	5	5	5	0
C-105	0.25	5	5	5	5	0
50 C-106	0.25	5	5	5	5	0

(97)

特開平10-72434

191

C-108	0.25	5	5	5	5	0
C-110	1	5	5	5	5	0
C-111	1	5	5	5	5	0

【0198】

【表49】

No.	薬量 kg/ha	A	G	H	I	d
C-113	0.25	5	5	5	5	0
C-115	1	5	5	5	5	0
C-116	1	5	4	5	5	0
C-117	1	5	5	5	5	0
C-118	0.25	5	5	5	5	0
C-119	0.25	5	5	5	5	0
C-120	0.25	5	5	5	5	0
C-121	0.25	5	5	5	5	0
C-122	0.25	5	5	5	5	0
C-123	1	5	5	5	5	0
C-124	0.25	5	5	5	5	0
C-125	0.25	5	5	5	5	0
C-126	1	5	5	5	5	0
C-127	1	5	5	5	5	0
C-128	0.25	5	5	5	5	0
C-132	1	3	5	5	5	0
C-134	1	5	5	5	5	0
C-135	1	5	5	5	5	0
C-137	0.25	5	5	5	5	0
C-139	1	5	5	5	5	0
C-140	0.25	5	5	5	5	0
C-141	0.25	5	5	5	5	0
C-143	0.25	5	5	5	5	0

【0199】

【表50】

No.	薬量 kg/ha	A	G	H	I	d
C-144	0.25	5	5	5	5	0
C-145	0.25	5	5	5	5	0
C-146	0.25	5	5	5	5	0
C-147	0.25	5	5	5	5	0
C-148	1	5	5	5	5	0
C-149	1	5	5	5	5	0
C-150	0.25	5	5	5	5	0

192

C-151	0.25	5	5	5	5	0
C-152	1	5	5	5	5	0
C-153	1	5	5	5	5	0
C-154	1	5	5	5	5	0
C-155	1	5	5	5	5	0
C-156	0.25	5	5	5	5	0
C-157	0.25	5	5	5	5	0
C-158	0.25	5	5	5	5	0
C-159	0.25	5	5	5	5	0
10 C-160	0.25	5	5	5	5	0
C-161	0.25	5	5	5	5	0
C-162	1	5	4	5	5	0
C-163	0.25	5	5	5	5	0
C-164	1	5	4	5	5	0
C-165	0.25	5	5	5	5	0
C-166	0.25	5	5	5	5	0

【0200】

【表51】

20

No.	薬量 kg/ha	A	G	H	I	d
C-167	1	5	5	5	5	0
C-168	0.25	5	5	5	5	0
D-1	0.25	5	5	5	5	0
D-2	0.25	5	5	5	5	0
D-3	0.25	5	5	5	5	0
D-4	0.25	5	5	5	5	0
D-5	0.25	5	5	5	5	0
30 D-6	0.25	5	5	5	5	0
D-7	0.25	5	5	5	5	0
D-8	0.25	5	5	5	5	0
D-9	1	5	5	5	5	0
D-11	0.25	5	5	5	5	0
D-12	0.25	5	5	5	5	0
D-13	1	5	5	5	5	0
D-14	0.25	5	5	5	5	0
D-15	0.25	5	5	5	5	0
D-16	0.25	5	5	5	5	0
40 D-17	0.25	5	5	5	5	0
D-18	0.25	5	5	5	5	0
D-19	0.25	5	5	5	5	0
D-20	0.25	5	5	5	5	0
D-21	0.25	5	5	5	5	0

フロントページの続き

(51)Int. Cl. ⁶	識別記号	庁内整理番号	FI	技術表示箇所
A01N 43/76			A01N 43/76	
43/78			43/78	B
43/80	101		43/80	101
	102			102
43/824			C07D 207/33	
43/836			207/34	
C07D 207/33			231/12	B
207/34				C
231/12			233/64	102
			233/68	
233/64	102		249/02	
233/68			249/08	
249/02			261/08	
249/08			263/32	
261/08			271/06	
263/32			271/10	
271/06			275/02	
271/10			277/22	
275/02			285/08	
277/22			A01N 43/82	101
285/08				104
285/12			C07D 285/12	A
(72)発明者 沢田 寛司			(72)発明者 縄巻 勤	
千葉県船橋市坪井町722番地1日産化学工業株式会社中央研究所内			埼玉県南埼玉郡白岡町大字白岡1470日産化学工業株式会社生物科学研究所内	
(72)発明者 玉田 佳丈			(72)発明者 石川 公広	
千葉県船橋市坪井町722番地1日産化学工業株式会社中央研究所内			埼玉県南埼玉郡白岡町大字白岡1470日産化学工業株式会社生物科学研究所内	
			(72)発明者 中平 国光	
			埼玉県南埼玉郡白岡町大字白岡1470日産化学工業株式会社生物科学研究所内	

WEST

Generate Collection

L15: Entry 1 of 1

File: JPAB

Mar 17, 1998

PUB-NO: JP410072434A

DOCUMENT-IDENTIFIER: JP 10072434 A

TITLE: 2, 4-SUBSTITUTED ANILINE DERIVATIVE

PUBN-DATE: March 17, 1998

INVENTOR-INFORMATION:

NAME

COUNTRY

KAWAMURA, YASUO

KITA, HIROSHI

NAKADA, HISASHI

SAWADA, KANJI

TAMADA, YOSHITAKE

NAWAMAKI, TSUTOMU

ISHIKAWA, KIMIHIRO

NAKAHIRA, KUNIMITSU

ASSIGNEE-INFORMATION:

NAME

COUNTRY

NISSAN CHEM IND LTD

APPL-NO: JP08282487

APPL-DATE: October 24, 1996

INT-CL (IPC): C07 D 207/325; A01 N 43/36; A01 N 43/50; A01 N 43/56; A01 N 43/653; A01 N 43/76; A01 N 43/78; A01 N 43/80; A01 N 43/80; A01 N 43/824; A01 N 43/836; C07 D 207/33; C07 D 207/34; C07 D 231/12; C07 D 233/64; C07 D 233/68; C07 D 249/02; C07 D 249/08; C07 D 261/08; C07 D 263/32; C07 D 271/06; C07 D 271/10; C07 D 275/02; C07 D 277/22; C07 D 285/08; C07 D 285/12

ABSTRACT:

PROBLEM TO BE SOLVED: To obtain a new compound useful as an agrochemical, especially as a herbicide.

SOLUTION: This 2,4-substituted aniline compound is expressed by formula I {R1 is a 1-4C (halo)alkyl, acetyl, etc.; R2 is H, a 1-3C alkyl, nitro, etc.; A is H, formyl, a 1-4C alkylcarbonyl, etc.; X is O, S, NR5 (R5 is H or an alkyl), etc.; R3 is a 1-7C alkyl, a 3-7C cycloalkyl, etc.; Q is formula II [R6 and R7 are each H or a 1-4C alkyl; Q1 is formula III (Y1 is a 1-4C haloalkyl, etc.; Y2 is H, a halogen, etc.; is 1 or 2), etc.], e.g., 1-(2-cyclopropanecarbonylamino-5-methylphenylmethyl)-5-methyl-3-trifluoromethylpyrazole. The compound of formula I is obtained by reacting an aniline derivative of formula IV with an acid, etc.

COPYRIGHT: (C)1998,JPO